

# Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP05/001623

International filing date: 27 January 2005 (27.01.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP  
Number: 2004-023317  
Filing date: 30 January 2004 (30.01.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 17 March 2005 (17.03.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland  
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

PCT/JP 2005/001623

日 本 国 特 許 庁  
JAPAN PATENT OFFICE

27.1.2005

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日  
Date of Application: 2 0 0 4 年 1 月 3 0 日

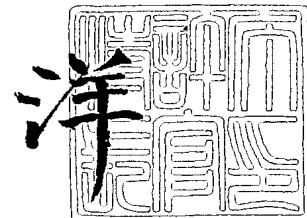
出 願 番 号  
Application Number: 特 願 2 0 0 4 - 0 2 3 3 1 7  
[ST. 10/C]: [ J P 2 0 0 4 - 0 2 3 3 1 7 ]

出 願 人  
Applicant(s): 長瀬産業株式会社

2 0 0 5 年 3 月 4 日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

小 川



出証番号 出証特 2 0 0 5 - 3 0 1 8 1 4 0

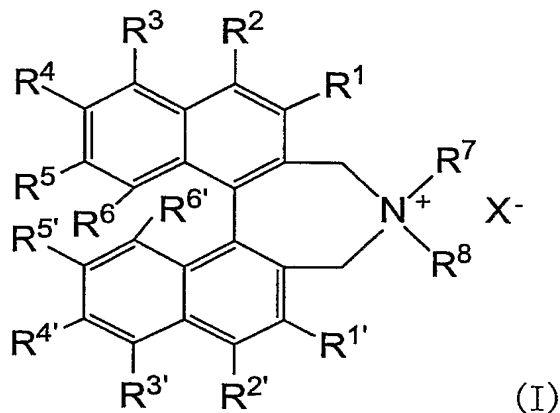
【書類名】 特許願  
【整理番号】 P103N08183  
【提出日】 平成16年 1月30日  
【あて先】 特許庁長官殿  
【発明者】  
    【住所又は居所】 京都府京都市左京区北白川追分町 京都大学大学院理学研究科化学専攻有機合成化学研究室内  
    【氏名】 丸岡 啓二  
【特許出願人】  
    【識別番号】 000214272  
    【氏名又は名称】 長瀬産業株式会社  
    【代表者】 長瀬 洋  
【代理人】  
    【識別番号】 100104673  
    【弁理士】  
    【氏名又は名称】 南條 博道  
【手数料の表示】  
    【予納台帳番号】 050740  
    【納付金額】 21,000円  
【提出物件の目録】  
    【物件名】 特許請求の範囲 1  
    【物件名】 明細書 1  
    【物件名】 要約書 1  
    【包括委任状番号】 0006435

【書類名】 特許請求の範囲

【請求項 1】

以下の式 (I) で表される、化合物：

【化 1】



ここで、

$R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

- (i) 水素原子；
  - (ii) アミド基；
  - (iii) シアノ基；
  - (iv) ニトロ基；
  - (v) カルバモイル基；
  - (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
  - (vii)  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
  - (viii)  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)；
  - (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；
  - (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；
  - (xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；
  - (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
    - シアノ基、
    - アミド基、
    - ニトロ基、
    - カルバモイル基、
    - $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
    - $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
    - $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)
- 、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）

、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）

、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、  
 R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> はそれぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルキニル基；

(v) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(vi) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> OCONR<sup>10</sup> R<sup>11</sup> (ここで、R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> はそれぞれ独立して、

- (1) 水素原子、  
(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
(3) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；  
(4) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；  
(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
(6) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

- 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

- (7) アリール基であって、該アリール基が  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、

カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ；

(viii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> CONR<sup>1 2</sup> R<sup>1 3</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、  
 (2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 (3) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が



分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である)；

(ix)  $-(CH_2)_n NR^{12} COR^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;  
 (x) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> NR<sup>1 2</sup> R<sup>1 3</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> およびR<sup>1 3</sup> はそれぞれ独立して

(1)水素原子、  
 (2)分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 (3)アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xi) —  $(CH_2)_n Y-OR^{12}$  (ここで、Yは分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  の二価の飽和炭化水素基であり、 $R^{12}$  は、

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N — ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基；N，N — ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
  - シアノ基、
  - アミド基、
  - ニトロ基、
  - カルバモイル基、
  - N — ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、
  - N，N — ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、
  - $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

- (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N — ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基；N，N — ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
  - シアノ基、
  - アミド基、
  - ニトロ基、
  - カルバモイル基、
  - N — ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、
  - N，N — ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、
  - $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ；

(xii) —  $(CH_2)_n -OR^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N — ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基；N，N — ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

$1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ；

(xiii)  $-(CH_2)_n-S-R^{1,2}$  (ここで、 $R^{1,2}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基；N，N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、  
 N，N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

(xiv)-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-SO-R<sup>12</sup>（ここで、R<sup>12</sup>は、

(1)水素原子、  
 (2)分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、  
 (3)アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基；N，N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、  
 N，N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基；N，N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、

アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xv)  $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

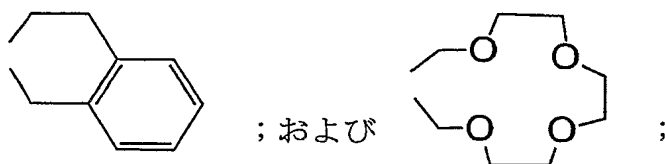
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、  
 $R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である)  
 ) ;

【化 2】



からなる群より選択される二価の基を表し、そして  
 $X^-$  は、ハロゲン化物アニオン、 $SCN^-$ 、 $HSO_4^-$ 、および  $HF_2^-$  からなる群より  
 選択されるアニオンである。

【請求項 2】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  が、それぞれ独立して、

水素原子；ならびに

アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキ  
 ル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；

からなる群より選択される基である、請求項 1 に記載の化合物。

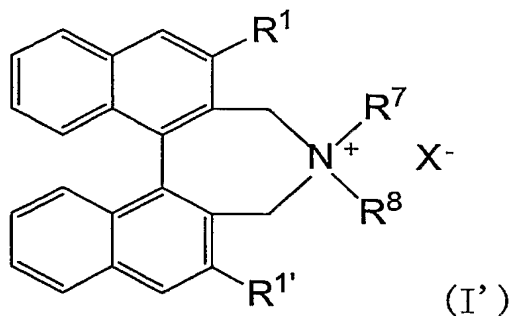
【請求項 3】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  が、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基  
 、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチル  
 フェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基  
 である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

前記式 (I) で表される化合物が、以下の式 (I') :

## 【化 3】



(ここで、 $R^1$  および  $R^{1'}$  は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基であり、そして  $R^7$ 、 $R^8$  および  $X^-$  は、それぞれ独立して、請求項 1 と同様に定義される基である) で表される化合物である、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  がそれぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  がそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、 $n$ -ブチル基、イソブチル基、 $n$ -デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である、請求項 5 に記載の化合物。

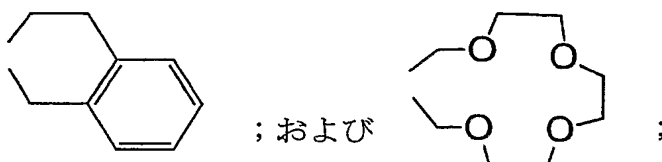
## 【請求項 7】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  がともに同一である、請求項 6 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  が一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である) ；

## 【化 4】



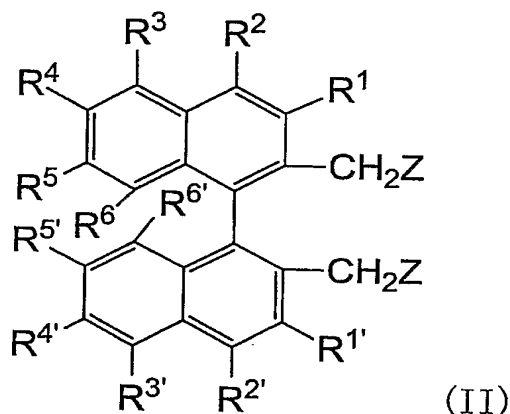
からなる群より選択される二価の基を表す、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

請求項 1 に記載の、式 (I) で表される化合物を製造するための方法であって、以下の式 (I I) ；

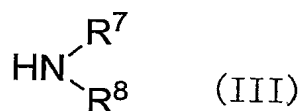


【化5】



で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、以下の式 (III) :

【化6】



で表される2級アミンと反応させる工程、を包含し、ここで、式 (II) において、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

- (i) 水素原子；
- (ii) アミド基；
- (iii) シアノ基；
- (iv) ニトロ基；
- (v) カルバモイル基；
- (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
- (vii)  $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
- (viii)  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)；
- (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；
- (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；
- (xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；
- (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim$

- C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
(xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；  
(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに  
(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、そして

$Z$  はハロゲン原子であり、

そして式 (III) において、

$R^7$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルキニル基；

(v) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(vi) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> OCONR<sup>10</sup> R<sup>11</sup> (ここで、R<sup>10</sup> およびR<sup>11</sup> はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、  
(2) 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
(3) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルケニル基；  
(4) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキニル基；  
(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
(6) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキ

ル基;

(7) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である);

(viii)  $-(CH_2)_n CONR^{12} R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、  
 (2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 (3) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、

アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である)；

(ix)  $-(CH_2)_n NR^{12} COR^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、  
 (2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 (3) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、な

らびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である）；

(x) $-(CH_2)_n NR^{12} R^{13}$ （ここで、 $R^{12}$  および $R^{13}$  はそれぞれ独立して

(1)水素原子、  
 (2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 (3)アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、

アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xi)  $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$  (ここで、 $Y$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  の二価の飽和炭化水素基であり、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール



基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xii) -  $(CH_2)_n - OR^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xiii) -  $(CH_2)_n - S - R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  ア

ルキル) カルバモイル基、または  $\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xiv)  $\text{-(CH}_2\text{)}_n\text{-SO-R}^{12}$  (ここで、 $\text{R}^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xv)  $-(CH_2)_n-SO_2-R^{1,2}$  (ここで、 $R^{1,2}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

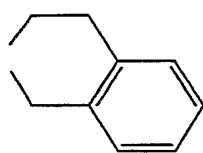
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

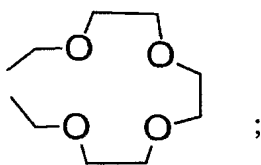
からなる群より選択される基であるか、あるいは、

R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は一緒になって、- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - (ここで、m は 2 から 8 の整数である) ;

#### 【化 7】



; および



からなる群より選択される二価の基を表す、方法。

#### 【請求項 10】

前記式 (I I) で表される化合物の R<sup>1</sup>、R<sup>1'</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>6'</sup> が、それぞれ独立して、水素原子; ならびに

アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基;

からなる群より選択される基である、請求項 9 に記載の方法。

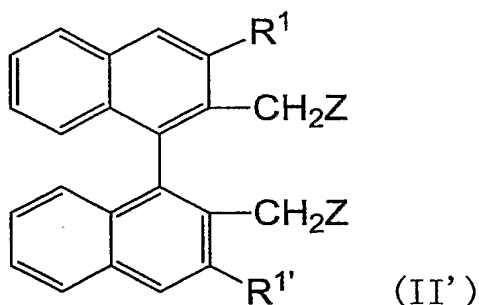
#### 【請求項 11】

前記式 (I I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  が、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基である、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 12】

前記式 (I I) で表される化合物が、以下の式 (I I') :

【化 8】



(ここで、 $R^1$  および  $R^{1'}$  は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基であり、そして  $R^7$ 、 $R^8$  および  $Z$  は、それぞれ独立して、請求項 9 と同様に定義される基である) で表される化合物である、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 13】

前記式 (I I) で表される 2 級アミンの  $R^7$  および  $R^8$  がそれぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基である、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 14】

前記式 (I I) で表される 2 級アミンの  $R^7$  および  $R^8$  がそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、 $n$ -ブチル基、イソブチル基、 $n$ -デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である、請求項 13 に記載の方法。

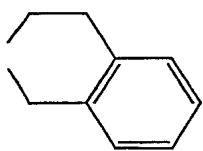
【請求項 15】

前記式 (I I) で表される 2 級アミンの  $R^7$  および  $R^8$  がともに同一である、請求項 14 に記載の化合物。

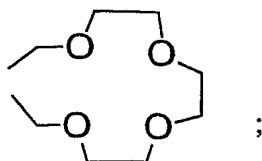
【請求項 16】

前記式 (I I) で表される 2 級アミンの  $R^7$  および  $R^8$  が一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である) ;

【化 9】



; および

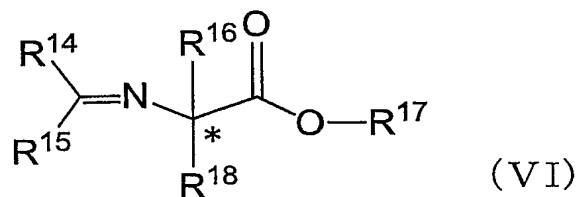


からなる群より選択される二価の基を表す、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 17】

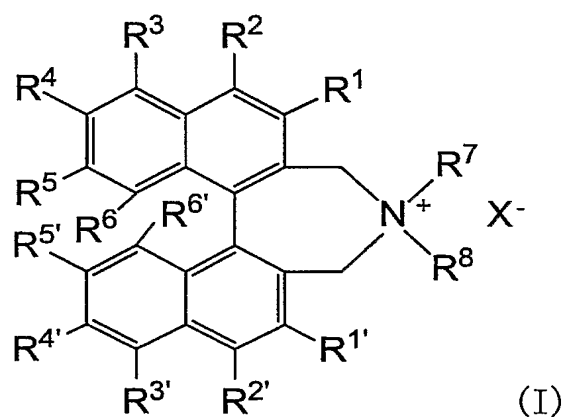
式 (VI) で表される化合物：

【化 10】



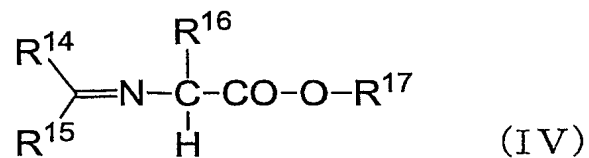
を立体選択的に製造するための方法であって、  
軸不斉に関して純粋な式 (I)：

【化 11】



で表される化合物を相間移動触媒として用い、式 (IV) で表される化合物：

【化 12】



を、媒体中、無機塩基の存在下、式 (V) の化合物：

## 【化13】

 $R^{18}-W$  (V)

でアルキル化する工程、を包含し、

ここで、式 (I) において、  
 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  
 $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

- (i) 水素原子；
- (ii) アミド基；
- (iii) シアノ基；
- (iv) ニトロ基；
- (v) カルバモイル基；
- (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
- (vii)  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
- (viii)  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)；
- (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；
- (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；
- (xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；
- (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$   
 カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)  
 、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
 (xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロア  
 リール部分が、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$   
 カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、

- アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキ  
ル基；  
(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
ル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~  
C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；な  
らびに  
(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
ル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~  
C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール  
基；  
からなる群より選択される基であり、  
R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> はそれぞれ独立して、  
(i) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されてい  
てもよい、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルキル基；



(ii)分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルケニル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルキニル基；

(iv)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(v)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vi)  $-(CH_2)_n OCONR^{10} R^{11}$  (ここで、 $R^{10}$  および  $R^{11}$  はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；

(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  ア

ルキル) カルバモイル基、または  $\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

(6) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

(7) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である)；

(vii)  $-(CH_2)_n CONR^{12} R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(viii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> NR<sup>1 2</sup> COR<sup>1 3</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(ix) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>1 2</sup>R<sup>1 3</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> はそれぞれ独立して

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
  - シアノ基、
  - アミド基、
  - ニトロ基、
  - カルバモイル基、
  - N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、
  - N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、
  - NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

- (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
  - シアノ基、
  - アミド基、
  - ニトロ基、
  - カルバモイル基、
  - N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、
  - N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、
  - NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(x) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>Y-OR<sup>1 2</sup> (ここで、Y は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> の二価の飽和炭化水素基であり、R<sup>1 2</sup> は、

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ア

ルキル) カルバモイル基、または  $\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xi)  $\text{-(CH}_2\text{)}_n\text{-OR}^{12}$  (ここで、 $\text{R}^{12}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基； $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である)；

(xii)- $(CH_2)_n-S-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基； $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基； $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xiii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - SO - R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

(1) 水素原子、  
 (2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 (3) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール



基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xiv)  $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) ; および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) ; および

ハロゲン原子

ハロゲン原子

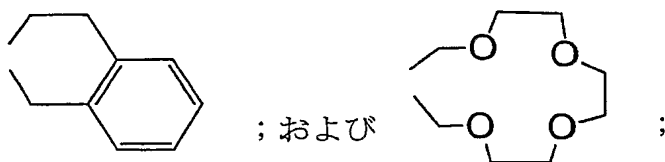
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

$R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である) ;

## 【化 14】



からなる群より選択される二価の基であり、そして

$X^-$  は、ハロゲン化物アニオンであり、

式 (IV) および式 (VI) において、

$R^{14}$  および  $R^{15}$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；あるいは

(ii) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基か、分岐していてもよい  $C_1 \sim C_{4.5}$  アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；であり、ただし  $R^{14}$  および  $R^{15}$  がともに水素原子である場合を除き、

$R^{16}$  は、

(i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$  のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキ  
 ル基；

(vii) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
 ル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~  
 C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；な  
 らびに

(viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
 ル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~  
 C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール  
 基；

からなる群より選択される基であり、  
 R<sup>17</sup> は、分岐または環を形成していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル基であり、  
 式 (V) および式 (VI) において、  
 R<sup>18</sup> は、

- (i) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル基；  
(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$  のアリル基または置換アリル基；  
(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；  
(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；  
(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキ  
ル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分  
が  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキ  
ル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキ  
ル基；  
(vii) アリール基であって、該アリール基が  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキ  
ル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、

カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；  
 (viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
 ル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~  
 C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール  
 基；ならびに  
 (ix) 分岐していてもよい、C<sub>3</sub> ~ C<sub>9</sub> のプロパルギル基または置換プロパルギル基；  
 からなる群より選択される基であり、  
 式 (V) において、  
 W は、脱離能を有する官能基であり、  
 そして式 (VI) において  
 \* は、新たに生成する不斉中心を示す、方法。

【請求項 18】

前記式 (I) で表される化合物の R<sup>1</sup>、R<sup>1'</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、R<sup>4</sup>、  
 R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>6'</sup> が、それぞれ独立して、  
 水素原子；ならびに  
 アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
 ル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~  
 C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；  
からなる群より選択される基である、請求項 17 に記載の方法。

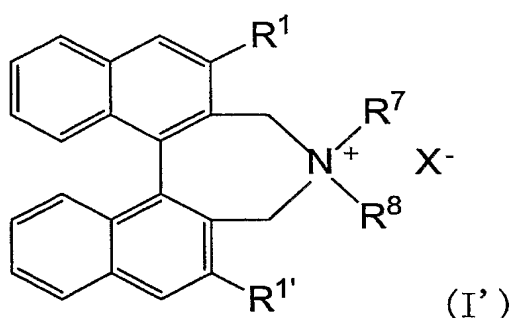
【請求項 19】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  が、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基である、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 20】

前記式 (I) で表される化合物が、以下の式 (I') :

【化 15】



(ここで、 $R^1$  および  $R^{1'}$  は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基であり、そして  $R^7$ 、 $R^8$  および  $X^-$  は、それぞれ独立して、請求項 1 と同様に定義される基である) で表される化合物である、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 21】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  がそれぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基である、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 22】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  がそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、 $n$ -ブチル基、イソブチル基、 $n$ -デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である、請求項 21 に記載の方法。

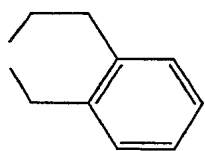
【請求項 23】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  がともに同一である、請求項 22 に記載の方法。

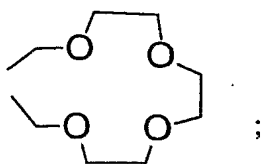
【請求項 24】

前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  が一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である) ;

【化 16】



；および



；

からなる群より選択される二価の基を表す、請求項 17 に記載の方法。

【書類名】明細書

【発明の名称】軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩およびそれを用いた $\alpha$ -アミノ酸誘導体の製造方法

【技術分野】

【0001】

本発明は、軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩およびその製造方法に関する。本発明はさらに、この軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩を相間移動触媒として用いた光学活性な $\alpha$ -アミノ酸誘導体の製造方法に関する。

【背景技術】

【0002】

式 $\text{H}_2\text{NCH(R)COOH}$ で表される $\alpha$ -アルキル- $\alpha$ -アミノ酸は、天然に存在する非常に重要なアミノ酸である。 $\alpha$ -アルキル- $\alpha$ -アミノ酸の大部分は、 $\alpha$ 位炭素においてL立体配置を有するL体として、動物、植物、微生物などに存在し、このL体はポリペプチド鎖を構成し得る。一方、D体は、植物、菌類、微生物中に非タンパク性の化合物として存在している。これらの $\alpha$ -アルキル- $\alpha$ -アミノ酸に対して、立体化学的に安定な炭素中心を有し、そしてペプチドに組込まれ得る $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジアルキル- $\alpha$ -アミノ酸は、特別な役割を果たすことで近年注目されている化合物である（非特許文献1および2）。例えば、増強された特性を有するペプチド、有効な酵素インヒビター、および種々の生物学的活性を有する化合物の合成用のキラル構築物ブロックなどとしての利用が考えられる。このような $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジアルキル- $\alpha$ -アミノ酸は、触媒不斉合成により調製できると考えられるが、現在のところ、その有効な調製方法は見出されていない。

【0003】

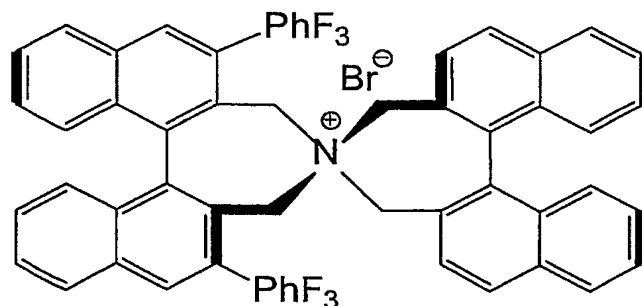
例えば、キラル相間移動触媒は、プロセス化学への適用が容易であるため、触媒不斉合成の分野で重要性が高まっている。これまでに、主としてシンコナアルカロイド誘導体を使用して、有効な相間移動触媒の設計についての多くの研究が行われ、多くの有用な方法が報告されている（例えば、非特許文献3および4参照）。しかし、このような相間移動触媒を用いる場合、ハロゲン系溶媒を使用すること、反応に長時間を要すること、低温条件が必要であることなどの種々の問題があった。上記の $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジアルキル- $\alpha$ -アミノ酸の合成においても、このようなシンコナアルカロイド由来のキラル相間移動触媒はあまり有用ではない。

【0004】

本発明者らは、軸不斉を有する光学活性な4級アンモニウム塩を調製し、上記 $\alpha$ -アミノ酸を立体選択的に合成する相間移動触媒として利用できることを明らかにした（特許文献1および2、非特許文献5参照）。例えば、以下の式：

【0005】

【化1】



【0006】



(ここで、 $\text{PhF}_3$  は 3, 4, 5-トリフルオロフェニル基を表す)  
で表されるスピロ型の化合物は、グリシン誘導体の不斉二重アルキル化および  $\alpha$ -アルキル- $\alpha$ -アミノ酸誘導体の不斉モノアルキル化を行うために非常に有効である。しかし、このようなスピロ型触媒の調製には、多くの工程が必要であり、例えば、入手が容易なキラルビナフトルを出発原料とする場合、11もの工程を要する。このように、調製に非常に手間がかかり、コスト高となることが重大な欠点である。

【特許文献1】特開 2001-48866 号公報

【特許文献2】特開 2003-81976 号公報

【非特許文献1】ベリアー, ティー. (Bellier, B.) ら, 「ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー (J. Med. Chem.)」, 1997年, 40巻, p. 3947

【非特許文献2】モーゼル, イー. (Mosse, E.) ら, 「テトラヘドロン・アシンメトリー (Tetrahedron Asymmetry)」, 1997年, 8巻, p. 1305

【非特許文献3】シオイリ, ティー. (Shioiri, T.) ら, 「ステイミュレイティング・コンセプツ・イン・ケミストリー (Stimulating Concepts in Chemistry)」, ボグトル, エフ. (Vogtle, F.) ら編, ウィリー・ブイシーエイチ (WILEY-VCH): ワインハイム (Weinheim), 2000年, p. 123

【非特許文献4】オドンネル, エム. ジェイ. (O'Donnell, M. J.)、  
「アルドリヒミカ・アクタ (Aldrichimica Acta)」, 2001年, 34巻, p. 3

【非特許文献5】オオイ, ティー. (Ooi, T.) ら, 「ジャーナル・オブ・アメリカン・ケミストリー・ソサイエティ (J. Am. Chem. Soc.)」, 2000年, 122巻, p. 5228

【非特許文献6】セキ, エム. (Seki, M.) ら, 「シンセシス (Synthesis)」, 2000年, p. 1677

【非特許文献7】オオイ, ティー. (Ooi, T.) ら, 「ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー (J. Org. Chem.)」, 2003年, 68巻, p. 4577

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0007】

本発明は、より少ない工程で製造可能な、単純化された構造を有するキラル相間移動触媒を提供することを目的とする。

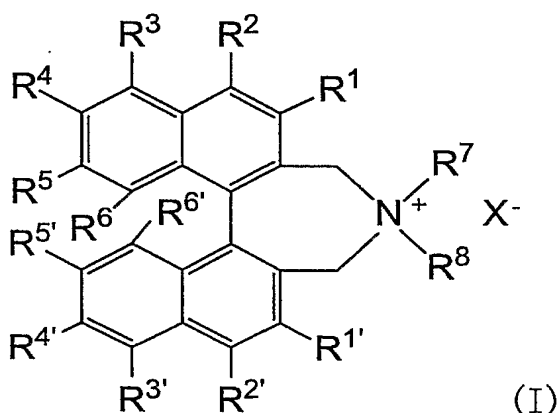
【課題を解決するための手段】

【0008】

本発明は、以下の式 (I) で表される、化合物:

【0009】

## 【化 2】



## 【0010】

を提供し、

ここで、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

- (i) 水素原子；
  - (ii) アミド基；
  - (iii) シアノ基；
  - (iv) ニトロ基；
  - (v) カルバモイル基；
  - (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
  - (vii)  $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
  - (viii)  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)；
  - (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；
  - (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；
  - (xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；
  - (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
    - シアノ基、
    - アミド基、
    - ニトロ基、
    - カルバモイル基、
    - $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
    - $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
    - $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)
- 、および
- ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラールキル基；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

からなる群より選択される基であり、

【0011】

R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> はそれぞれ独立して、

(i) 水素原子;

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルキル基;

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルケニル基;

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルキニル基;

(v) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基;

(vi) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

(vii) —(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> OCONR<sup>10</sup> R<sup>11</sup> (ここで、R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
(3)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；  
(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；  
(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7)アリール基であって、該アリール基が  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である)；

(viii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> CONR<sup>1 2</sup> R<sup>1 3</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である)；

(ix)  $-(CH_2)_n NR^{12} COR^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(x) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> NR<sup>1 2</sup> R<sup>1 3</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> はそれぞれ独立して

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xi) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> Y-OR<sup>1 2</sup> (ここで、Y は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> の二価



の飽和炭化水素基であり、 $R^{12}$  は、

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
  - シアノ基、
  - アミド基、
  - ニトロ基、
  - カルバモイル基、
  - $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
  - $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、
  - $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

- (4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
  - シアノ基、
  - アミド基、
  - ニトロ基、
  - カルバモイル基、
  - $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
  - $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、
  - $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xii)  $-(CH_2)_n-OR^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ；

(xiii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - S - R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

(1) 水素原子、  
 (2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 (3) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、な

らびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である）；

(xiv)  $-(CH_2)_n-SO-R^{1,2}$ （ここで、 $R^{1,2}$ は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xv) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - SO<sub>2</sub> - R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

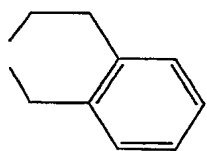
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

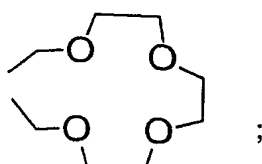
からなる群より選択される基であるか、あるいは、  
 $R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である)  
 ) ;

【0012】

【化3】



; および



;

【0013】

からなる群より選択される二価の基を表し、そして

【0014】

$X^-$  は、ハロゲン化物アニオン、 $SCN^-$ 、 $HSO_4^-$ 、および  $HF_2^-$  からなる群より  
 選択されるアニオンである。

【0015】

好適な実施態様によれば、上記式 (I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

水素原子; ならびに

アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$   
 カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基;  
 からなる群より選択される基である。

【0016】

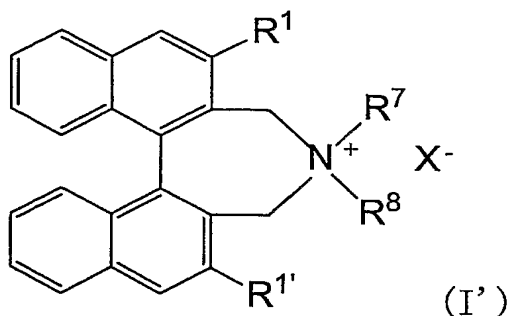
より好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基である。

【0017】

さらに好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物は、以下の式 (I') :

【0018】

【化4】



【0019】

(ここで、 $R^1$  および  $R^{1'}$  は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基であり、そして  $R^7$ 、 $R^8$  および  $X^-$  は、それぞれ独立して、上記と同様に定義される基である) で表される化合物である。

【0020】

好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基である。

【0021】

別の好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、 $n$ -ブチル基、イソブチル基、 $n$ -デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である。

【0022】

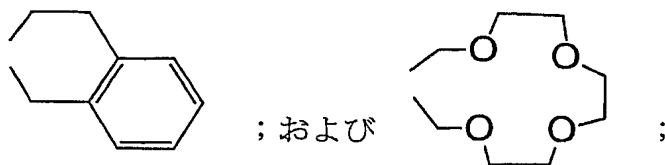
より好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  はとも同一である。

【0023】

他の好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は2から8の整数である) ;

【0024】

【化5】



【0025】

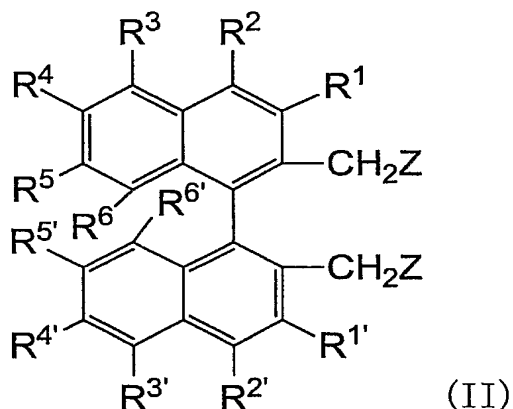
からなる群より選択される二価の基を表す。

【0026】

本発明はまた、上記式 (I) で表される化合物を製造するための方法を提供し、この方法は、以下の式 (II) :

【0027】

【化6】

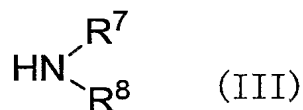


【0028】

で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、以下の式 (III) :

【0029】

【化7】



【0030】

で表される 2 級アミンと反応させる工程、を包含し、

【0031】

ここで、式 (II) において、

$R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

- (i) 水素原子；
- (ii) アミド基；
- (iii) シアノ基；
- (iv) ニトロ基；
- (v) カルバモイル基；
- (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
- (vii)  $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
- (viii)  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)；
- (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；
- (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基;

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキ  
ル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

(xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロア  
リール部分が、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキ  
ル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキ  
ル基;

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキ  
ル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim$   
 $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、



—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、そして

Z はハロゲン原子であり、

### 【0032】

そして式 (III) において、

R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> はそれぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>12</sub> のアルキニル基；

(v) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(vi) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vii)  $-(CH_2)_n OCONR^{10} R^{11}$  (ここで、 $R^{10}$  および  $R^{11}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、  
 (2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 (3) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；  
 (4) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；  
 (5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(6) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、

ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である)；

(viii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> CONR<sup>1 2</sup> R<sup>1 3</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である)；

(ix)  $-(CH_2)_n NR^{12} COR^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、  
 (2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 (3) アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、

ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ；

(x) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> NR<sup>1 2</sup> R<sup>1 3</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> および R<sup>1 3</sup> はそれぞれ独立して

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である）；

(xi)- $(CH_2)_n Y-OR^{12}$ （ここで、 $Y$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  の二価の飽和炭化水素基であり、 $R^{12}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$  アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xii) -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-OR<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xiii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - S - R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N - ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
  - シアノ基、
  - アミド基、
  - ニトロ基、
  - カルバモイル基、
  - N - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、
  - N, N - ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、
  - NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

- 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
- 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、
- 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N - ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
- シアノ基、
- アミド基、
- ニトロ基、
- カルバモイル基、
- N - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、
- N, N - ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、
- NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xiv) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - SO - R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

- (1) 水素原子、
- (2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
- (3) アリール基であって、該アリール基が
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N - ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、



シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xv) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - SO<sub>2</sub> - R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、な

らびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基；N，N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、  
 N，N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

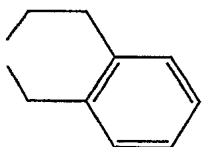
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

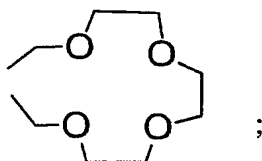
R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は一緒になって、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-（ここで、mは2から8の整数である）；

【0033】

【化8】



；および



；

【0034】

からなる群より選択される二価の基を表す。

【0035】

好適な実施態様では、上記式(II)で表される化合物のR<sup>1</sup>、R<sup>1'</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、R<sup>6</sup>およびR<sup>6'</sup>は、それぞれ独立して

、

水素原子；ならびに

アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、N，N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；  
 からなる群より選択される基である。

【0036】

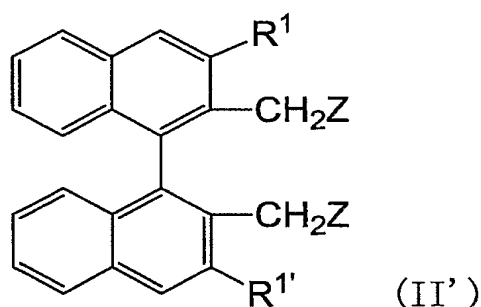
より好適な実施態様では、上記式 (I I) で表される化合物の R<sup>1</sup>、R<sup>1'</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>6'</sup> は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基である。

【0037】

さらにより好適な実施態様では、上記式 (I I) で表される化合物は、以下の式 (I I')

【0038】

【化 9】



【0039】

(ここで、R<sup>1</sup> および R<sup>1'</sup> は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基であり、そして R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup> および Z は、それぞれ独立して、上記と同様に定義される基である) で表される化合物である。

【0040】

別の好適な実施態様では、上記式 (I I) で表される 2 級アミンの R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> はそれぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよい、C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub> のアルキル基である。

【0041】

より好適な実施態様では、上記式 (I I) で表される 2 級アミンの R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> はそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、n-ブチル基、イソブチル基、n-デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である。

【0042】

さらに好適な実施態様では、上記式 (I I) で表される 2 級アミンの R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は

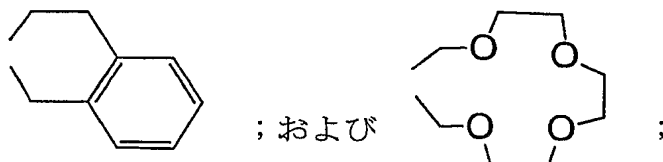
ともに同一である。

【0043】

他の好適な実施態様では、上記式 (I I) で表される 2 級アミンの  $R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である) ；

【0044】

【化 10】



【0045】

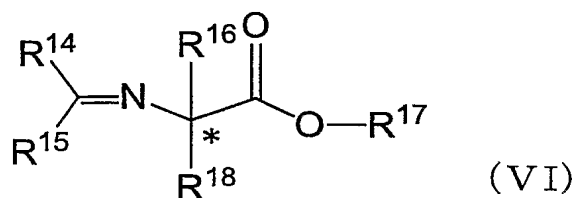
からなる群より選択される二価の基を表す。

【0046】

本発明はさらに、式 (V I) で表される化合物：

【0047】

【化 11】

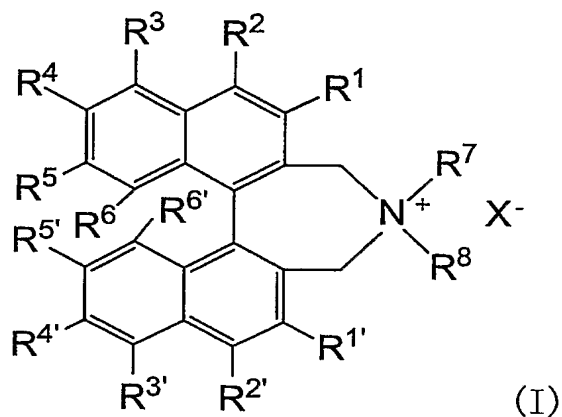


【0048】

を立体選択的に製造するための方法を提供し、この方法は、軸不斉に関して純粋な式 (I) ；

【0049】

【化 1 2】

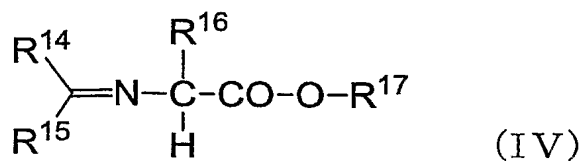


【0050】

で表される化合物を相間移動触媒として用い、式 (I V) で表される化合物:

【0051】

【化 1 3】



【0052】

を、媒体中、無機塩基の存在下、式 (V) の化合物:

【0053】

【化 1 4】



【0054】

でアルキル化する工程、を包含し、

【0055】

ここで、式 (I) において、  
 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  
 $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

- (i) 水素原子;
- (ii) アミド基;
- (iii) シアノ基;

- (iv) ニトロ基;
- (v) カルバモイル基;
- (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;
- (vii)  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;
- (viii)  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である);
- (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基;
- (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基;
- (xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基;
- (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
  - シアノ基、
  - アミド基、
  - ニトロ基、
  - カルバモイル基、
  - $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
  - $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
  - $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

(xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

- 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
- 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
- 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
- シアノ基、
- アミド基、
- ニトロ基、
- カルバモイル基、
- $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
- $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
- $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

- (xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
  - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

ル) カルバモイル基、または  $\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$   
 $\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$   
 $\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$   $\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$  または  $\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

【0056】

$\text{R}^7$  および  $\text{R}^8$  はそれぞれ独立して、

(i) 分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{12}$  のアルキル基；

(ii) 分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{12}$  のアルケニル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{12}$  のアルキニル基；

(iv) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$   $\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$  または  $\text{-NHCO R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

- カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；  
 (v) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
 モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
 ル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~  
 C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
 、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール  
 基；  
 (vi) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> OCONR<sup>10</sup> R<sup>11</sup> (ここで、R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> はそれぞれ独  
 立して、  
 (1) 水素原子、  
 (2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 (3) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルケニル基；  
 (4) 分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> のアルキニル基；  
 (5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カ  
 ルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アル  
 キル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C  
<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基であ  
 る)、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
 (6) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール  
 部分が、



分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラールキル基；

(7) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(vii) -  $(CH_2)_n CONR^{12} R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) 、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) 、および

## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(viii) -  $(CH_2)_n NR^{12} COR^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である)；

(ix)  $-(CH_2)_n NR^{12} R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  はそれぞれ独立して

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、

カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である)；

(x)  $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$  (ここで、 $Y$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  の二価の飽和炭化水素基であり、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である)；

(xi)  $-(CH_2)_n-OR^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - S - R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

(xiii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - SO - R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、

(1) 水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 (3)アリール基であって、該アリール基が  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
   シアノ基、  
   アミド基、  
   ニトロ基、  
   カルバモイル基、  
    $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
    $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
    $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
   シアノ基、  
   アミド基、  
   ニトロ基、  
   カルバモイル基、  
    $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
    $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
    $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は1から12の整数である) ; ならびに

(xiv)  $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1)水素原子、  
 (2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
 (3)アリール基であって、該アリール基が  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
   分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
   シアノ基、  
   アミド基、

ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

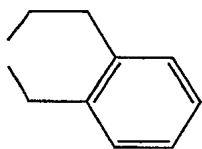
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして n は 1 から 12 の整数である) ;

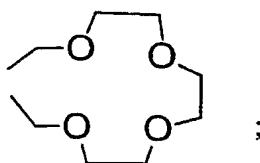
からなる群より選択される基であるか、あるいは、  
R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> は一緒になって、- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - (ここで、m は 2 から 8 の整数である) ;

【0057】

【化15】



; および



;

【0058】

からなる群より選択される二価の基であり、そして

【0059】

X<sup>-</sup> は、ハロゲン化物アニオンであり、

【0060】

式 (IV) および式 (VI) において、

R<sup>1-4</sup> および R<sup>1-5</sup> は、それぞれ独立して、



(i) 水素原子; あるいは  
(ii) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基か、分岐していてもよい  $C_1 \sim C_{4.5}$  アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基; であり、ただし  $R^{1.4}$  および  $R^{1.5}$  がともに水素原子である場合を除き、 $R^{1.6}$  は、

(i) 水素原子;  
(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$  のアルキル基;  
(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基;  
(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基;  
(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;  
(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

(vii) アリール基であって、該アリール基が  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、  
分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)

ル) カルバモイル基、または  $\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 アミド基、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $\text{N-(C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$   
 $\text{N, N-ジ(C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$   
 $\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)  
 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N-(C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$   $\text{N, N-ジ(C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$  または  $\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N-(C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ(C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

【0061】

$\text{R}^{17}$  は、分岐または環を形成していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$  アルキル基であり、

【0062】

式 (V) および式 (VI) において、

$\text{R}^{18}$  は、

(i) 分岐または環を形成していてもよい、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$  アルキル基；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_9$  のアリル基または置換アリル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$  のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$  のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N-(C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$   $\text{N, N-ジ(C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル) カルバモイル基、}$  または  $\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；  
(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分

が  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基；N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
ル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~  
C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキ  
ル基；

(vii) アリール基であって、該アリール基が  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
ル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~  
C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
アミド基、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)  
、および

ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；  
(viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、  
分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバ  
モイル基、N- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキ  
ル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~

C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基; ならびに

(ix) 分岐していてもよい、C<sub>3</sub> ~ C<sub>9</sub> のプロパルギル基または置換プロパルギル基; からなる群より選択される基であり、

【0063】

式 (V) において、

W は、脱離能を有する官能基であり、

【0064】

そして式 (VI) において

\* は、新たに生成する不斉中心を示す。

【0065】

好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の R<sup>1</sup>、R<sup>1'</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>6'</sup> は、それぞれ独立して、水素原子; ならびに

アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup> は分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基; からなる群より選択される基である。

【0066】

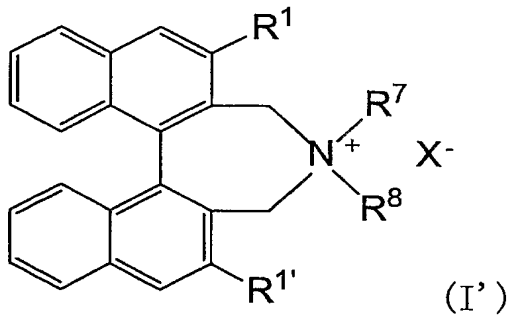
より好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の R<sup>1</sup>、R<sup>1'</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>6'</sup> は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基である。

【0067】

さらに好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物は、以下の式 (I') :

【0068】

【化16】



【0069】

(ここで、 $R^1$  および  $R^{1'}$  は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基であり、そして  $R^7$ 、 $R^8$  および  $X^-$  は、それぞれ独立して、上記と同様に定義される基である) で表される化合物である。

【0070】

別の好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基である。

【0071】

より好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して、メチル基、エチル基、 $n$ -ブチル基、イソブチル基、 $n$ -デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される基である。

【0072】

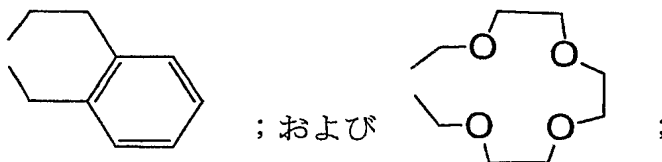
より好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  はともに同一である。

【0073】

他の好適な実施態様では、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は2から8の整数である) ；

【0074】

【化17】



【0075】

からなる群より選択される二価の基を表す。

【発明の効果】

【0076】

本発明によれば、より単純化された構造のキラル相間移動触媒が提供される。この相間移動触媒は、従来の化合物よりもより少ない工程により製造することができる。このように、より容易に提供され得る本発明の相間移動触媒は、 $\alpha$ -アルキル- $\alpha$ -アミノ酸誘導体および $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジアルキル- $\alpha$ -アミノ酸の合成に利用され得る。

【発明を実施するための最良の形態】

【0077】

以下、本明細書中で用いられる用語を定義する。

【0078】

用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_n$  のアルキル基」(ここで  $n$  は整数)は、炭素数  $1 \sim n$  の任意の直鎖アルキル基、炭素数  $3 \sim n$  の任意の分岐鎖アルキル基、および炭素数  $3 \sim n$  の任意の環状アルキル基を包含する。例えば、炭素数  $1 \sim 6$  の任意の直鎖アルキル基としては、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $n$ -ブチル、ペンチル、ヘキシルが挙げられ、炭素数  $3 \sim 6$  の任意の分岐鎖アルキル基としては、イソプロピル、イソブチル、tert-ブチル、イソペンチルなどが挙げられ、そして炭素数  $3 \sim 6$  の任意の環状アルキル基としては、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基」という場合は、炭素数  $1 \sim 12$  の直鎖アルキル基、炭素数  $3 \sim 12$  の任意の分岐鎖アルキル基、および炭素数  $3 \sim 12$  の任意の環状アルキル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルキル基としては、 $n$ -ヘプチル、イソヘプチル、 $n$ -オクチル、イソオクチル、 $n$ -デシル、 $n$ -ドデシルなどが挙げられる。

【0079】

なお、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基および  $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$  アルキル)カルバモイルにおいて、「 $C_1 \sim C_4$  アルキル」は、 $C_1 \sim C_4$  の直鎖アルキル基または  $C_3 \sim C_4$  の分岐鎖アルキル基を意味する。

【0080】

用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_n$  のアルケニル基」(ここで  $n$  は整数)は、炭素数  $2 \sim n$  の任意の直鎖アルケニル基、炭素数  $3 \sim n$  の任意の分岐鎖アルケニル基、および炭素数  $3 \sim n$  の任意の環状アルケニル基を包含する。例えば、炭素数  $2 \sim 6$  の任意の直鎖アルケニル基としては、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニルなどが挙げられ、炭素数  $3 \sim 6$  の任意の分岐鎖アルケニル基としては、イソプロペニル、1-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、などが挙げられ、そして炭素数  $3 \sim 6$  の任意の環状アルケニル基としては、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルケニル基」という場合は、炭素数  $2 \sim 12$  の直鎖アルケニル基、炭素数  $3 \sim 12$  の任意の分岐鎖アルケニル基、および炭素数  $3 \sim 12$  の任意の環状アルケニル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルケニル基としては、1-ヘプテニル、2-ヘプテニル、1-オクテニル、1-デセニル、1-ドデセニルなどが挙げられる。

【0081】

用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_n$  のアルキニル基」(ここで  $n$  は整数)は、炭素数  $2 \sim n$  の任意の直鎖アルキニル基、炭素数  $3 \sim n$  の任意の分岐鎖アルキニル基、および炭素数  $3 \sim n$  の任意の環状アルキニル基を包含する。例えば、炭素数  $2 \sim 6$  の任意の直鎖アルキニル基としては、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、1-ペンチニル、1-ヘキシニルなどが挙げられ、炭素数  $3 \sim 6$  の任意の分岐鎖アルキニル基としては、1-メチル-2-プロピニルなどが挙げられ、そして炭素数  $3 \sim 6$  の任意の環状アルキニル基としては、シクロプロピルエチニル、シ

クロブチルエチニルなどが挙げられる。さらに、例えば、用語「分岐または環を形成していてもよい、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルキニル基」という場合は、炭素数 1 ～ 12 の直鎖アルキニル基、炭素数 3 ～ 12 の任意の分岐鎖アルキニル基、および炭素数 3 ～ 12 の任意の環状アルキニル基を包含し、これらの任意の位置の水素原子がハロゲン原子で置換されていてもよい。このようなアルキニル基としては、1-ヘプチニル、1-オクチニル、1-デシニル、1-ドデシニルなどが挙げられる。

【0082】

用語「分岐していてもよい  $C_1 \sim C_n$  のアルコキシ基」(ここで  $n$  は整数) は、炭素数 1 ～  $n$  の任意の直鎖アルキル基を有するアルコキシ基および炭素数 3 ～  $n$  の任意の分岐鎖アルキル基を有するアルコキシ基を包含する。例えば、メチルオキシ、エチルオキシ、 $n$ -プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、*tert*-ブチルオキシなどが挙げられる。

【0083】

本発明において、用語「アラルキル基」の例としては、ベンジル、フェネチル、およびナフチルメチルが挙げられる。

【0084】

本発明における用語「ヘテロアラルキル基」の例としては、ピリジルメチル、インドリルメチル、フリルメチル、チエニルメチル、およびピロリルメチルが挙げられる。

【0085】

本発明において、用語「アリール基」の例としては、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントリルなどが挙げられる。

【0086】

本発明における用語「ヘテロアリール基」の例としては、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル、フリル、インドリル、チエニル、オキサゾリル、チアゾリル、およびテトラゾリルが挙げられる。

【0087】

本発明において、用語「ハロゲン原子」の例としては、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子およびフッ素原子が挙げられる。なお、本発明において、用語「ハロゲン化物アニオン」とは、ハロゲンイオンのことを意味し、塩化物イオン、臭化物イオン、ヨウ化物イオン、およびフッ化物イオンが挙げられる。

【0088】

本発明において、用語「分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_n$  のアリル基または置換アリル基」(ここで  $n$  は整数) は、アリル基、あるいは 1 および／または 2 および／または 3 位に置換基を有する任意の合計炭素数 4 ～  $n$  の置換アリル基を意味する。例えば、2-ブテニル、1-シクロペンテニルメチル、3-メチル-2-ブテニルなどが挙げられる。

【0089】

本発明において、用語「分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_n$  のプロパルギル基または置換プロパルギル基」(ここで  $n$  は整数) は、プロパルギル基、あるいは 1 および／または 3 位に置換基を有する任意の合計炭素数 4 ～  $n$  の置換プロパルギル基を意味する。例えば、2-ブチニル、3-トリメチルシリル-2-プロピニルなどが挙げられる。

【0090】

本発明において、用語「脱離能を有する官能基」は、置換反応または脱離反応などにおいて、反応基質から離れていく原子または原子団、すなわち脱離基を意味する。例えば、ハロゲン原子、スルホニルオキシ基などが挙げられる。

【0091】

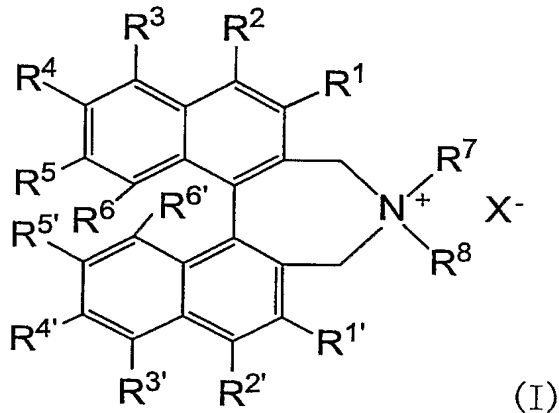
以下、本発明について詳述する。

【0092】

本発明の 4 級アンモニウム塩は、軸不斉に関して純粋であり、以下の式 (I) :

【0093】

## 【化18】



## 【0094】

(ここで、

$R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

- (i) 水素原子；
  - (ii) アミド基；
  - (iii) シアノ基；
  - (iv) ニトロ基；
  - (v) カルバモイル基；
  - (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
  - (vii)  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；
  - (viii)  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)；
  - (ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；
  - (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；
  - (xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；
  - (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、
    - 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、
    - シアノ基、
    - アミド基、
    - ニトロ基、
    - カルバモイル基、
    - $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
    - $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、
    - $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)
- 、および

ハロゲン原子

からなる群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキ



ル基;

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基; ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

からなる群より選択される基であり、  
 $R^7$  および  $R^8$  はそれぞれ独立して、

(i)分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基;

(ii)分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルケニル基;

(iii)分岐または環を形成していてもよく、および/またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルキニル基;

(iv)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

(v)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

(vi)  $-(CH_2)_n OCONR^{10} R^{11}$  (ここで、 $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基;

(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基;

(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

(7)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、 ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は1から12の整数である);

(vii)  $-(CH_2)_n CONR^{12} R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、 ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は1から12の整数である);

(viii)  $-(CH_2)_n NR^{12} COR^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくと

も 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(ix) -  $(CH_2)_n NR^{12} R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(x) -  $(CH_2)_n Y-OR^{12}$  (ここで、 $Y$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  の二価の飽和炭化水素基であり、 $R^{12}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xi) -  $(CH_2)_n -OR^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xii) -  $(CH_2)_n -S-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xiii) -  $(CH_2)_n -SO-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ; ならびに

(xiv) -  $(CH_2)_n -SO_2 -R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも

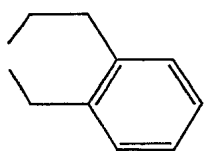
も 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

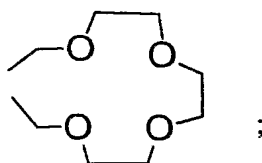
からなる群より選択される基であるか、あるいは、  
 $R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である)  
);

【0095】

【化19】



; および



;

【0096】

からなる群より選択される二価の基であり、そして

$X^-$  は、ハロゲン化物アニオン、 $SCN^-$ 、 $HSO_4^-$ 、または  $HF_2^-$  である) で表される化合物である。上記式 (I) で表される化合物は、(S) または (R) のいずれの立体配置を有していてもよい。

【0097】

上記式 (I) で表される化合物は、例えば、光学活性な  $\alpha$ -アミノ酸誘導体、特に、 $\alpha$ -ジアルキル- $\alpha$ -アミノ酸誘導体を製造するための相間移動触媒として有用である。

【0098】

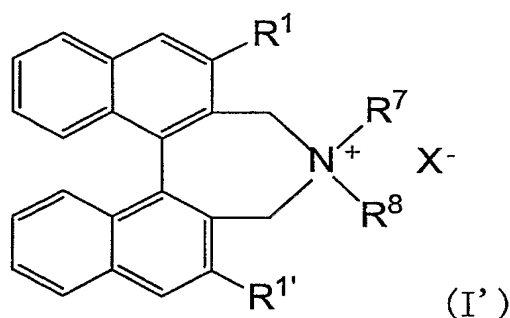
本発明においては、上記式 (I) において、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、好ましくは、それぞれ独立して

、  
水素原子; ならびに

アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基; からなる群より選択され、より好ましくは、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および 3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される。特に、上記式 (I) で表される化合物のうち、以下の式 (I') :

【0099】

## 【化20】



## 【0100】

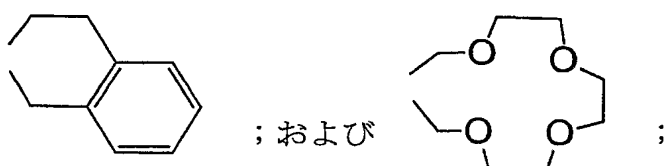
(ここで、 $R^1$  および  $R^{1'}$  は、それぞれ独立して、水素原子、フェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、および3, 5-トリフルオロメチルフェニル基からなる群より選択される基であり、そして  $R^7$ 、 $R^8$  および  $X^-$  は、それぞれ独立して、上で定義される基である) で表される化合物が好ましい。

## 【0101】

また、上記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  は、好ましくは、それぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよい  $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基であり、より好ましくは、メチル基、エチル基、 $n$ -ブチル基、イソブチル基、 $n$ -デシル基、およびシクロヘキシル基からなる群より選択される。さらに、 $R^7$  および  $R^8$  はともに同一であることが好ましく、あるいは、 $R^7$  および  $R^8$  が一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は2から8の整数である) ;

## 【0102】

## 【化21】



## 【0103】

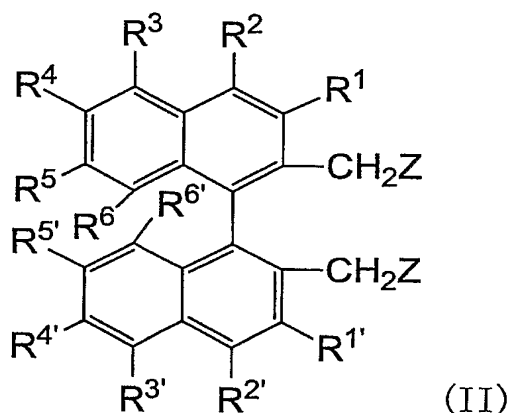
からなる群より選択される二価の基である化合物も好ましい。

## 【0104】

上記式 (I) で表される4級アンモニウム塩は、以下の式 (II) :

## 【0105】

【化 2 2】



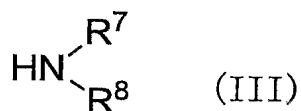
【0106】

(ここで、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、上記式 (I) において定義されたものと同様であり、そして Z はハロゲン原子である)

で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、以下の式 (III) :

【0107】

【化 2 3】



【0108】

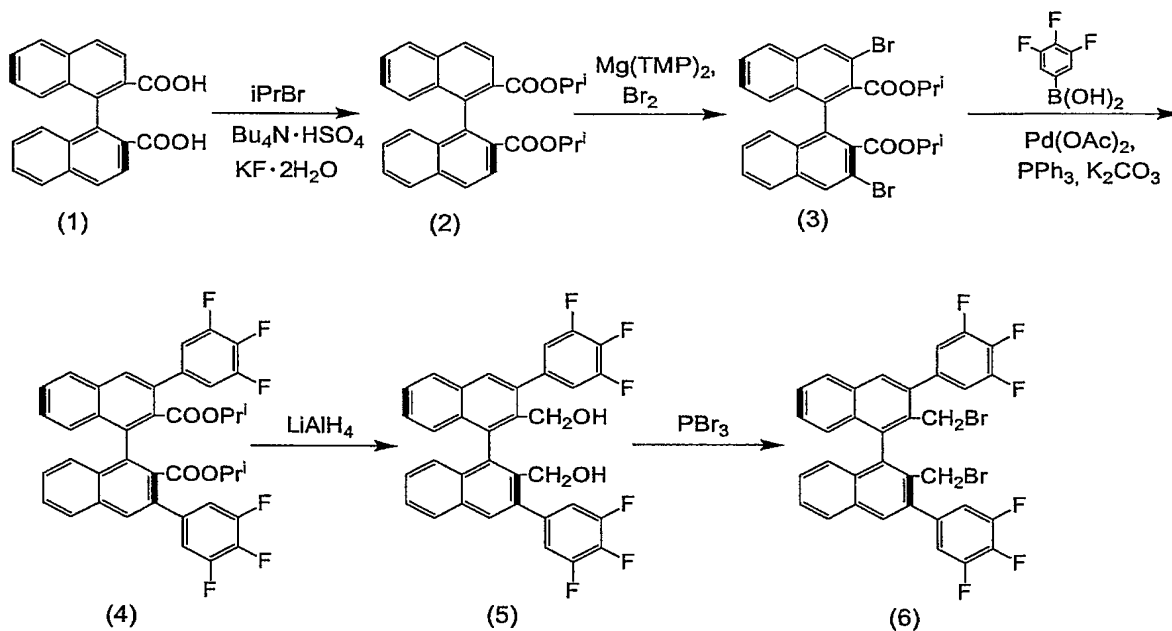
(ここで、 $R^7$  および  $R^8$  は、上記式 (I) において定義されたものと同様である)  
で表される 2 級アミンと反応させることによって製造することができる。

【0109】

上記式 (II) の化合物は、例えば、容易に入手可能な 1, 1'-ビナフチル-2, 2'-ジカルボン酸 (非特許文献 6 参照) から、以下のスキーム 1 に記載のような公知の工程で容易に調製され得る (非特許文献 7 参照)。1, 1'-ビナフチル-2, 2'-ジカルボン酸は、(S) 体または (R) 体のいずれであってもよい。

【0110】

## 【化 2 4】



スキーム1

## 【0111】

上記スキーム1に基づいて具体的に説明する。まず、ジカルボン酸(1)を、臭化イソプロピル、触媒  $\text{Bu}_4\text{N} \cdot \text{HSO}_4$ 、および  $\text{KF} \cdot 2\text{H}_2\text{O}$  を用いて、対応するジイソプロピルエステル(2)に変換する。得られた化合物(2)を、ビス(2,2,6,6-テトラメチルピペラミド)マグネシウム(以下、 $\text{Mg}(\text{TMP})_2$  という)で処理し、続いて  $\text{Br}_2$  を添加して、3,3'-ジブプロモ-1,1'-ジナフチル-2,2'-ジカルボン酸エステル(3)を得る。次いで、酢酸パラジウム、トリフェニルホスフィン、および炭酸カリウムの存在下で、得られた化合物(3)と3,4,5-トリフルオロフェニルボロン酸とのSuzuki-Miyauraの交差カップリング反応を行って、3,3'-ビス(3,4,5-トリフルオロフェニル)-1,1'-ジナフチル-2,2'-ジカルボン酸エステル(4)を得る。さらに、この(4)を  $\text{LiAlH}_4$  で還元し、次いで得られた粗アルコール(5)を  $\text{PBr}_3$  で処理して、上記式(II)に相当するジブプロミド(6)を得ることができる。

## 【0112】

一方、上記式(III)の2級アミンは、市販されているものが多く、入手が容易であるため、適宜選択することができる。

## 【0113】

上記式(I)の化合物の製造のための反応工程に用いられる有機溶媒としては、ニトリル系溶媒(例えば、アセトニトリル、プロピオニトリルなど)、エーテル系溶媒(例えば、ジオキサン、テトラヒドロフラン、イソプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、2-メトキシエチルエーテルなど)、アルコール系溶媒(例えば、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、*tert*-ブタノールなど)などが挙げられる。本発明においては、特に、アセトニトリルが好ましい。酸捕捉剤としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナト

リウムなどの無機塩基が挙げられる。

#### 【0114】

上記反応において、式 (I I I) の 2 級アミンは、式 (I I) の化合物に対して好ましくは 1 ~ 4 当量、より好ましくは 2 ~ 3 当量用いられる。酸捕捉剤は、式 (I I) の化合物に対して好ましくは 1 ~ 4 当量、より好ましくは約 1 ~ 2 当量用いられる。式 (I I) の化合物と式 (I I I) の 2 級アミンとは、酸捕捉剤の存在下で、適切な有機溶媒中、攪拌しながら反応させる。反応温度は、好ましくは、室温から有機溶媒の沸点までであり、より好ましくは加熱還流下で反応が行われる。反応時間は、好ましくは 30 分 ~ 24 時間、より好ましくは 6 ~ 12 時間である。このとき、有機溶媒は、式 (I I) の化合物に対して容積 (mL) / 重量 (g) 比で、好ましくは 5 ~ 50 倍、より好ましくは 5 ~ 30 倍の量を用いる。反応終了後、反応混合物を、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素などによる抽出、シリカゲルカラムクロマトグラフィーなどによって単離・精製して、式 (I) の化合物を得ることができる。あるいは、反応混合物を、そのまま以下に詳述する  $\alpha$ -アミノ酸誘導体の製造方法に相間移動触媒として使用してもよい。

#### 【0115】

このようにして得られた式 (I) の化合物は、 $X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる軸不斉に関して純粋な形態であり、相間移動触媒として使用され得る。ここで、「軸不斉に関して純粋」とは、軸不斉に基づいて考えられる各種立体異性体のうち、1 つの特定の異性体の存在率が、他の異性体より多いことをいう。好ましくは、当該 1 つの特定の異性体の存在率は、90% 以上、より好ましくは 95% 以上、さらにより好ましくは 98% 以上である。

#### 【0116】

さらに、上記  $X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる式 (I) の化合物は、例えば、以下の工程を経て、ハロゲン化物アニオンが  $SCN^-$ 、 $HSO_4^-$ 、または  $HF_2^-$  に変換された化合物とすることができる。

#### 【0117】

まず、 $X^-$  が  $SCN^-$  または  $HSO_4^-$  である式 (I) の化合物の製造方法について説明する。

#### 【0118】

上記のようにして得られた  $X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる式 (I) の化合物は、特開 2002-173492 号公報に記載の方法に準じて、例えば、適切な第二の有機溶媒中に溶解し、チオシアン酸アルカリ金属塩の飽和水溶液と混合することにより、 $X^-$  であるハロゲン化物アニオンが、 $SCN^-$  に変換される。

#### 【0119】

この交換において使用可能な第二の有機溶媒の例としては、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン、テトラヒドロフラン、メチルtertブチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、および酢酸エチルが挙げられる。チオシアン酸アルカリ金属塩の例としては、チオシアン酸カリウムおよびチオシアン酸ナトリウムが挙げられる。

#### 【0120】

$X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる式 (I) の化合物と、チオシアン酸アルカリ金属塩との反応は、例えば、室温のような比較的温和な条件下の溶液中で混合接触することにより、容易に進行し、反応生成物（すなわち、 $X^-$  が  $SCN^-$  でなる式 (I) の化合物を定量的収率で得ることができる。

#### 【0121】

また、上記  $X^-$  が  $SCN^-$  でなる式 (I) の化合物は、濃硝酸と反応させることにより、 $X^-$  が  $SCN^-$  から、さらに  $HSO_4^-$  へと容易に変換される。

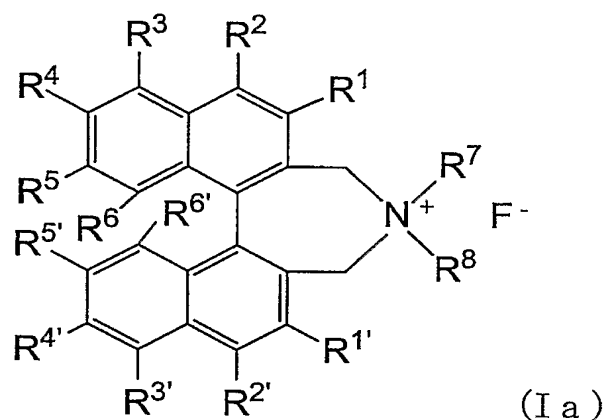
#### 【0122】

このようにして得られた  $X^-$  が  $HSO_4^-$  でなる式 (I) の化合物は、さらにフッ化アルカリ金属塩（例えば、フッ化カリウム、フッ化ナトリウム、またはフッ化リチウム）と反応させることによって、例えば、シリルエノールエーテルとカルボニル化合物との反応

(アルドール反応)における触媒として利用可能な式 (I a) :

【0123】

【化25】



【0124】

(ここで、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、上記式 (I) において定義されたものと同様である) で表される化合物を得ることもできる。

【0125】

上記アルドール反応において使用されるシリルエノールエーテルは、例えば、トリルアルキルシリルエノールエーテルである。トリルアルキルシリルエノールエーテルは、トリメチルシリルクロリド、トリエチルシリルクロリドなどのクロロシランを、塩基の存在下にてカルボニル化合物 (例えば、2-ブタノン、4-ペンテン-2-オン、ジエチルケトン、アセトフェノン、プロピオフェノン、ブチロナフトン、シクロキシヘサノン、1-オキソインダン、1-テトラロン、または2-テトラロンのようなケトン誘導体) と反応させることにより予め調製され得る。

【0126】

上記アルドール反応において使用されるシリルエノールエーテルと反応するカルボニル化合物には、シリルエノールエーテルの前駆体であるカルボニル化合物 (上記ケトン誘導体) に加えて、アセチルアルデヒド、プロピオンアルデヒド、ブチルアルデヒド、イソブチルアルデヒド、イソバレールアルデヒド、カプロンアルデヒド、ドデシルアルデヒド、パルミチンアルデヒド、ステアリンアルデヒド、アクロレイン、クロトンアルデヒド、シクロヘキサンカルブアルデヒド、ベンズアルデヒド、アニスアルデヒド、ニコチンアルデヒド、シンナムアルデヒド、 $\alpha$ -ナフトアルデヒド、 $\beta$ -ナフトアルデヒドなどのアルデヒド化合物が挙げられる。

【0127】

このようなシリルエノールエーテルおよびカルボニル化合物に対し、式 (I a) で表される化合物は、上記アルドール反応の触媒として使用され、当該反応の立体選択性を制御することができる。

【0128】

次に、 $X^-$  が  $HF_2^-$  である式 (I) の化合物の製造方法について説明する。

【0129】

上記のようにして得られた  $X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる式 (I) の化合物は、まず、イオン交換樹脂と接触させられ、第一の中間体が生成される。

【0130】



上記イオン交換樹脂は、当業者によって任意のものが選択可能である。使用可能なイオン交換樹脂の具体的な例としては、アンバーリスト A 26 (OH) (オルガノ社製) が挙げられる。

【0131】

$X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる式 (I) の化合物とイオン交換樹脂との接触は、例えば、上記  $X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる式 (I) の化合物を適切な第三の溶媒に溶解し、この溶液を当該イオン交換樹脂を充填したカラムに通すことにより行われる。このような接触を行う際に使用され得る第三の溶媒はアルコール溶媒が好ましい。アルコール溶媒の具体的な例としては、メチルアルコール、エチルアルコール、イソプロピルアルコール、およびノルマルプロピルアルコールが挙げられるが、特にこれらに限定されない。

【0132】

この接触において使用される上記  $X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる式 (I) の化合物および第三の溶媒の量は、特に限定されず、当業者によって適切に設定され得る。

【0133】

このようにして、第一の中間体が生成される。

【0134】

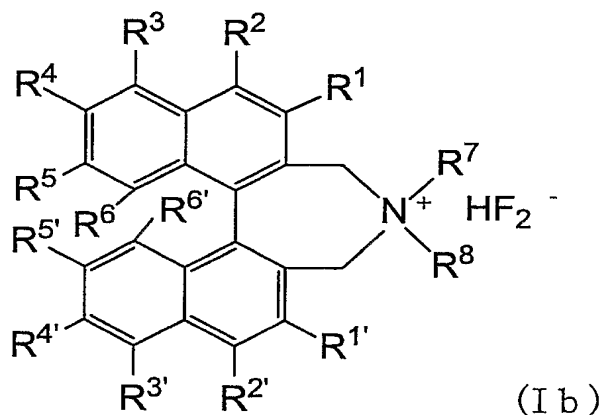
次いで、得られた第一の中間体は、好ましくは上記溶媒を除去することなく、フッ化水素水溶液と中和させられる。

【0135】

本発明に用いられるフッ化水素水溶液の使用量は、特に限定されないが、生産性を高める点から、好ましくは、上記で使用した  $X^-$  がハロゲン化物アニオンでなる式 (I) の化合物に対して等量以上のフッ化水素が反応するように選択される。これにより、第一の中間体が中和され、溶液中に、 $X^-$  がハロゲン化物アニオンから、さらに  $HF_2^-$  へと変換された式 (I b) :

【0136】

【化 26】



【0137】

で表される化合物を沈殿させることができる。

【0138】

その後、この式 (I b) の化合物は、当業者が通常用いる手段を用いて溶媒を除去することにより、容易に単離され得る。

【0139】

このようにして得られた、式 (I b) の化合物は、例えば、ジアステレオ選択的かつエナンチオ選択的に制御されたニトロアルコールを生成するための触媒としても利用され得

る。

【0140】

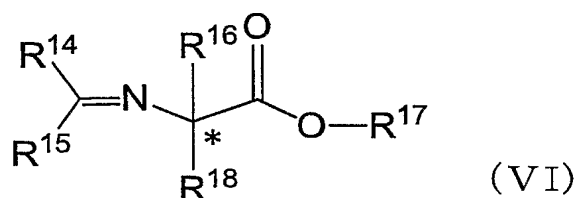
次に、式 (I) で表される本発明の 4 級アンモニウム化合物を相間移動触媒として用いて、 $\alpha$ -アミノ酸誘導体を製造する方法について説明する。

【0141】

式 (VI) で表される  $\alpha$ -アミノ酸誘導体：

【0142】

【化 27】



【0143】

(ここで、

$R^{14}$  および  $R^{15}$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；あるいは

(ii) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基か、分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；であり、ただし  $R^{14}$  および  $R^{15}$  がともに水素原子である場合を除き、

$R^{16}$  は、

(i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$  のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、アミド基、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

アミド基、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

、および

ハロゲン原子

からなる群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロ

アラルキル基；

(vii) アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

$R^{17}$  は、分岐または環を形成していてもよい  $C_1 \sim C_8$  アルキル基であり、

$R^{18}$  は、

(i) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$  アルキル基；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$  のアリル基または置換アリル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(vii) アリール基であって、該アリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が、上記群 (Q) より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

(ix) 分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_9$  のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

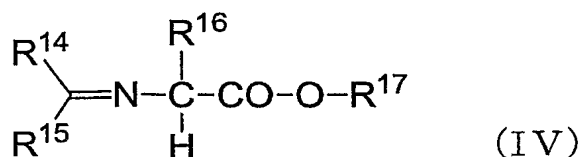
からなる群より選択される基であり、そして

\* は、新たに生成する不斉中心を示す) は、

式 (IV) で表される化合物：

【0144】

【化28】



【0145】

(ここで、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、および  $R^{17}$ 、上記式 (VI) において定義されたものと同様である)

を、媒体中、無機塩基の存在下、上記式 (I) で表される化合物を相間移動触媒として用いて、式 (V) の化合物：

【0146】

【化29】



## 【0147】

(ここで、 $R^{18}$  は、上記式 (VI) において定義されたものと同様であり、そして W は、脱離能を有する官能基である) でアルキル化する工程によって、立体選択的に製造することができる。

## 【0148】

この工程で用いられる媒体としては、ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルエーテル、イソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどが挙げられる。あるいは、媒体は、これらのうちの水と混ざらない媒体と水との二相系媒体であってもよい。媒体は、式 (IV) の化合物に対して容積 (mL) / 重量 (g) 比で好ましくは 5 ~ 30 倍、より好ましくは 8 ~ 25 倍を使用し得る。

## 【0149】

この工程で用いられる無機塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化ルビジウム、水酸化セシウムなどが挙げられる。無機塩基は、式 (IV) の化合物に対して好ましくは 2 ~ 10 当量、より好ましくは 3 ~ 7 当量を使用し得る。無機塩基は、10 ~ 60 w/v % のアルカリ水溶液として用いてもよく、その場合の容量は、式 (IV) の化合物に対して容積 (mL) / 重量 (g) 比で好ましくは 4 ~ 20 倍、より好ましくは 8 ~ 15 倍であり得る。

## 【0150】

上記アルキル化工程において、式 (V) の化合物は、式 (IV) の化合物に対して、好ましくは 1 ~ 1.5 当量、より好ましくは 1.1 ~ 1.3 当量、さらにより好ましくは 1.2 ~ 1.25 当量用いる。式 (I) の化合物は、式 (IV) の化合物に対して、好ましくは 0.005 ~ 0.05 当量、より好ましくは 0.0075 ~ 0.03 当量を相間移動触媒として用いる。アルキル化工程は、-30℃ から室温までの間の適切な温度、好ましくは -20℃ ~ 0℃ で、空气中、好ましくはアルゴン雰囲気下にて行われる。この工程は、アルキル化反応が十分に進行するまで適切な時間にわたって、攪拌しながら行われ得る。反応時間は、好ましくは 30 分 ~ 48 時間、より好ましくは 1 時間 ~ 24 時間である。

## 【0151】

上記のような本発明の式 (I) の化合物を用いる本発明の方法によれば、光学活性な式 (VI) の化合物を、高収率かつ高光学純度で得ることができる。ここで、高光学純度とは、好ましくは 85 % ee 以上、より好ましくは 90 % ee 以上、さらに好ましくは 95 % ee 以上の光学純度であることをいう。

## 【0152】

得られた式 (VI) の化合物は、さらに、例えば、テトラヒドロフラン中でクエン酸などの酸で室温にて処理することにより、二重結合を介して窒素原子に連結している部分が脱離して、末端アミノ基が遊離しているアミノ酸化合物を得ることができる。

## 【実施例】

## 【0153】

以下、本発明を実施例によって具体的に記述するが、これらによって本発明は制限されるものではない。

## 【0154】

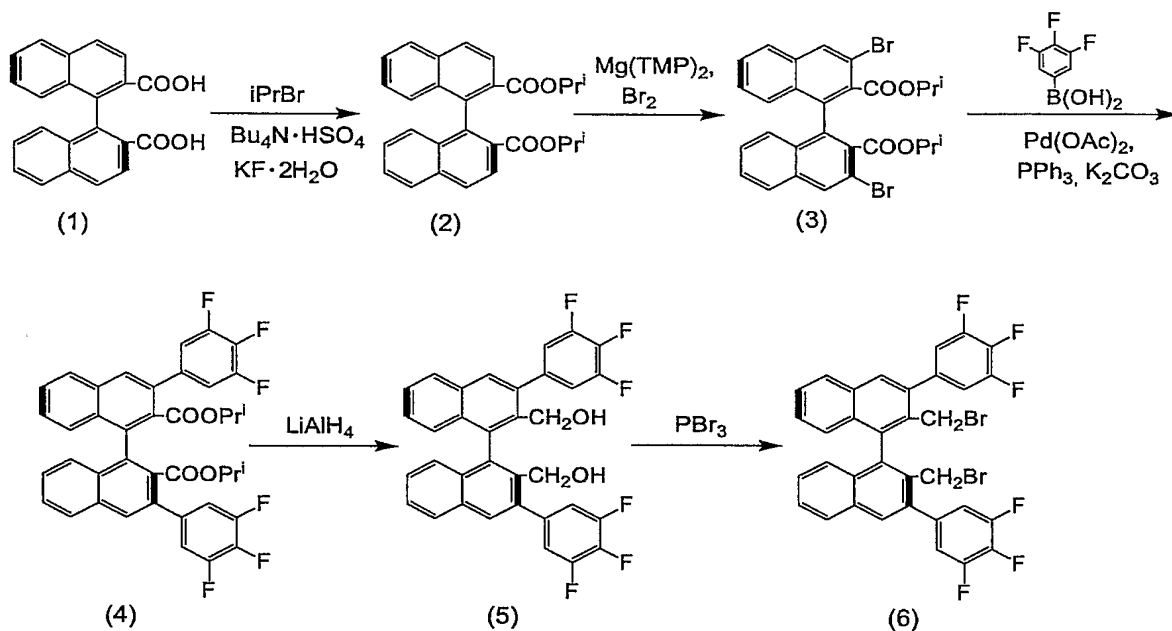
なお、以下の実施例においては、 $^1\text{H}$  NMR スペクトルを、JEOL JNM-FX 400 (400 MHz) スペクトロメータ、および JMT-C-400/54/SS (400 MHz) スペクトロメータで測定した。反応生成物の光学純度は、高速液体クロマトグラフィー (HPLC) を、4.6 mm × 25 cm Daicel Chiralcel OD、OD-H、AD、または AD-H を用いて、Shimadzu 10 装置で測定した。反応の進行は、薄層クロマトグラフィー (TLC) は、Merck precoated TLC プレート (シリカゲル 60 GF254, 0.25 mm) を用いてモニタリングした。

## 【0155】

< 参考例 1: 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 6) の合成 >

【0156】

【化30】



スキーム1

【0157】

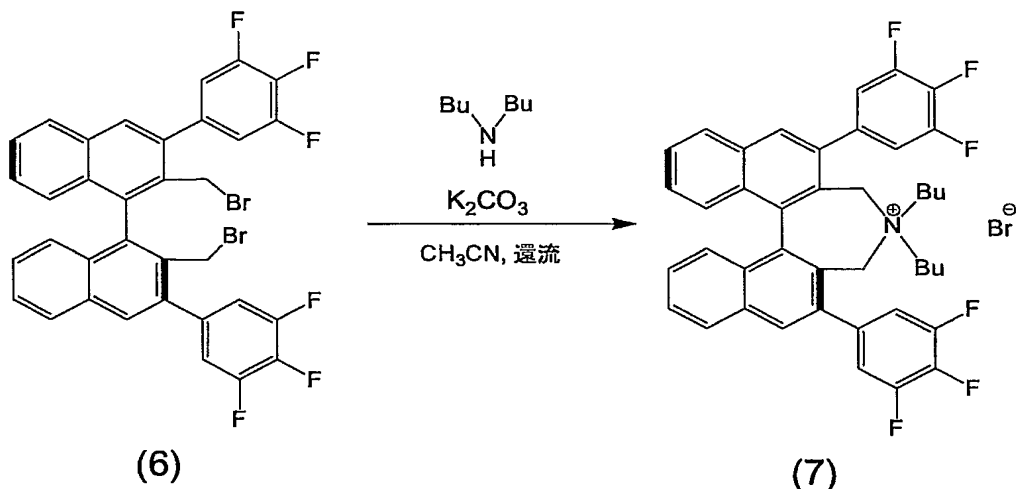
化合物1 (S体)、化合物1に対して10当量の臭化イソプロピル、20mol%の触媒  $\text{Bu}_4\text{N} \cdot \text{HSO}_4$ 、および10当量のフッ化カリウム2水和物を、テトラヒドロフラン中還流下で24時間反応させて、化合物2を95%の収率で得た。この化合物2に、テトラヒドロフラン中新たに調製した4当量の  $\text{Mg}(\text{TMP})_2$  を0℃で滴下し、続いて-78℃で8当量の臭素を滴下し、その後、室温で1時間攪拌して、化合物3を91%の収率で得た。化合物3を、ジメチルホルムアミド中5mol%の酢酸パラジウム、15mol%の  $\text{PPh}_3$ 、および3当量の炭酸カリウムの存在下で、2.4当量の3,4,5-トリフルオロフェニルボロン酸とのSuzuki-Miyauraの交差カップリング反応を90℃にて8時間行って、化合物4を94%の収率で得た。次いで、化合物4を、0℃~室温にてテトラヒドロフラン中3当量の  $\text{LiAlH}_4$  で還元し、次いで得られた化合物5を、0℃にてテトラヒドロフラン中0.5当量の  $\text{PBr}_3$  と1時間攪拌して、化合物6 (S体) を90%の収率で得た。なお、R体についても、同様の手順により調製した。

【0158】

<実施例1: 4級アンモニウム塩(化合物7)の合成>

【0159】

## 【化 3 1】



## 【0160】

アセトニトリル (5 mL) 中の化合物 6 (S 体) (280 mg, 0.4 mmol)、ジブチルアミン (140  $\mu$ L, 0.8 mmol)、および炭酸カリウム (82 mg, 0.6 mmol) の混合物を、攪拌しながら 10 時間加熱還流した。得られた混合物を水中に注ぎ、そしてジクロロメタンで抽出した。有機層抽出物を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、そして濃縮した。残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: メタノール/ジクロロメタン = 1:20) に付して精製し、化合物 7 (S 体) (247 mg, 0.33 mmol) を 83% の収率で得た。

## 【0161】

得られた化合物 7 (S 体) の NMR スペクトルは以下のとおりであった:  $^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.97–7.95 (4H, m, Ar–H), 7.55–7.51 (2H, m, Ar–H), 7.27–7.23 (8H, m, Ar–H), 4.99 (2H, d,  $J=14.2$  Hz, Ar– $\text{CH}_2$ ), 3.74 (2H, d,  $J=13.9$  Hz, Ar– $\text{CH}_2$ ), 3.32 (2H, t,  $J=12.5$  Hz, N– $\text{CH}_2$ – $\text{CH}_2$ ), 2.56 (2H, t,  $J=12.3$  Hz, N– $\text{CH}_2$ – $\text{CH}_2$ ), 1.06–0.97 (6H, m,  $\text{CH}_2$ ), 0.71 (6H, t,  $J=6.9$  Hz,  $\text{CH}_3$ ), 0.23 (2H, bs,  $\text{CH}_2$ );  $^{13}\text{C}$  NMR (100 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  150.95 (d,  $J_{\text{C}-\text{F}}=253$  Hz), 139.61 (ddd,  $J_{\text{C}-\text{F}}=253, 15, 15$  Hz), 138.31, 136.86, 134.64 (d,  $J_{\text{C}-\text{F}}=4$  Hz), 133.44, 131.13, 130.85, 128.31, 128.28, 127.66, 127.37, 123.34, 115.31–113.76 (m), 57.58, 57.37, 24.60, 19.32, 13.24。

## 【0162】

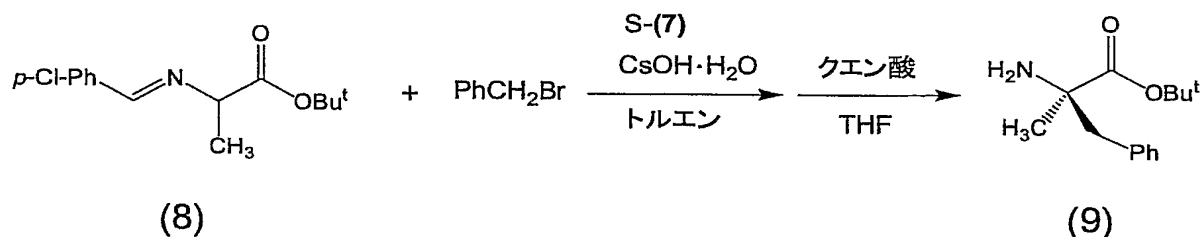
化合物 6 の R 体についても、同様の手順を行い、化合物 7 (R 体) を得た。

## 【0163】

<実施例 2: アラニンの  $\alpha$ -ベンジル化の確認>

## 【0164】

## 【化 3 2】



## 【0165】

トルエン 2 mL 中のアラニン- (t) -ブチルエステル- p-クロロベンジルシッフ塩基 (化合物 8) (134 mg, 0.5 mmol)、1 モル% の化合物 7 (S 体)、および臭化ベンジル (1.2 当量) の混合物に、水酸化セシウム・一水和物 (5 当量) を 0℃ で加え、アルゴン雰囲気下で 0℃ にて 3 時間攪拌した。反応混合物を水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出し、溶媒を留去して、テトラヒドロフラン 5 mL に溶解した。0.5 M クエン酸水溶液 5 mL を添加し、室温にて 1 時間攪拌した。水層をエーテルで洗浄し、炭酸水素ナトリウムでアルカリ性とした後、ジクロロメタンで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して、油状物を得た。得られた油状物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液: 酢酸エチル/ヘキサン = 2/1) にかけて、アラニンのベンジル化生成物 (化合物 9) を 82% の収率で 97% ee で得た。得られた生成物の光学純度は、HPLC にて分析した [Daicel Chiralcel AD; 溶離液: ヘキサン/イソプロパノール = 30:1, 0.5 mL/分; 保持時間: (R) 体 = 12.9 分、(S) 体 = 20.5 分]。

## 【0166】

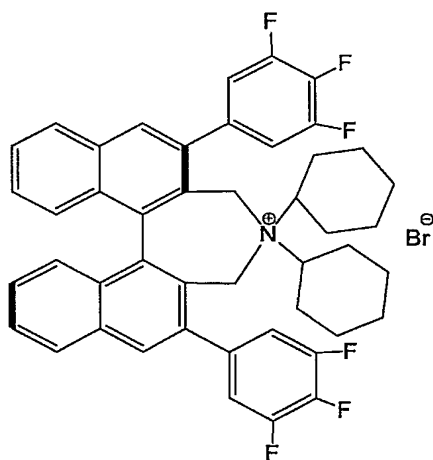
なお、アルゴン雰囲気下での工程を -20℃ にて行ったところ、85% の収率でかつ実質的に完全なエナンチオ選択性 (99% ee) を有する化合物 9 を得ることができた。

## 【0167】

<実施例 3: 4 級アンモニウム塩 (化合物 10) の合成>

## 【0168】

## 【化 3 3】



(10)

## 【0169】

上記化合物 6 の R 体 (140 mg, 0.2 mmol) を用い、そしてジブチルアミンの代わりにジシクロヘキシルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 10 (R 体) (96 mg, 0.12 mmol) を 60% の収率で得た。

## 【0170】

得られた化合物の NMR スペクトルは以下のとおりであった：<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8.05 (4H, bs, Ar-H), 7.65 (2H, t, J=7.7 Hz, Ar-H), 7.49 (4H, bs, Ar-H), 7.38 (2H, t, J=7.5 Hz, Ar-H), 7.27-7.24 (2H, m, Ar-H), 5.15 (2H, d, J=13.9 Hz, Ar-CH<sub>2</sub>), 4.20 (2H, d, J=13.5 Hz, Ar-CH<sub>2</sub>), 3.18 (2H, bs, CH<sub>2</sub>), 3.05 (1H, bs, N-CH), 2.34 (2H, d, J=9.9 Hz, CH<sub>2</sub>), 2.16 (2H, d, J=8.7 Hz, CH<sub>2</sub>), 1.82-0.88 (15H, m, CH および CH<sub>2</sub>) ; <sup>13</sup>C NMR (100 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 151.08 (d, J<sub>C-F</sub>=249 Hz), 139.56 (d, J<sub>C-F</sub>=254 Hz), 138.43, 136.76, 134.80 (d, J<sub>C-F</sub>=3.3 Hz), 133.34, 131.61, 131.05, 128.33, 127.78, 127.44, 123.58, 115.05-114.82 (m), 73.95, 54.89, 53.37, 52.99, 30.36, 28.69, 28.39, 26.62, 26.45, 24.88, 24.76。

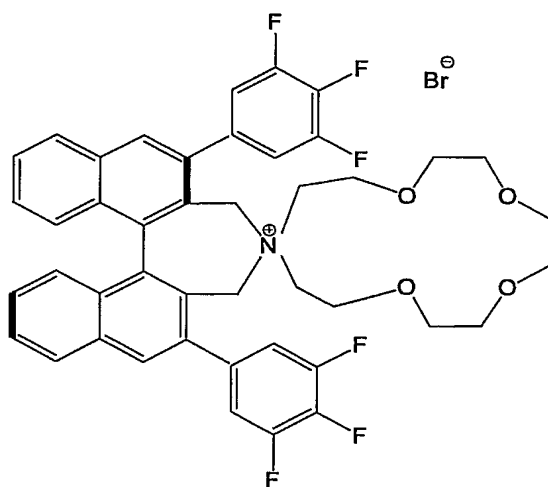
## 【0171】

<実施例 3: 4 級アンモニウム塩 (化合物 11) の合成>

## 【0172】



## 【化 3 4】



(11)

## 【0173】

上記化合物 6 の R 体 (140 mg, 0.2 mmol) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりに 1-アザ-4, 7, 10, 13-テトラオキサシクロペンタデカンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 11 (59 mg, 0.07 mmol) を 35% の収率で得た。

## 【0174】

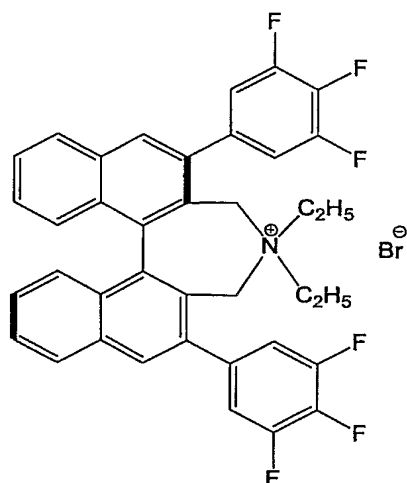
得られた化合物の NMR スペクトルは以下のとおりであった:  $^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.05–8.03 (4 H, m, Ar-H), 7.68–7.64 (2 H, m, Ar-H), 7.43–7.35 (4 H, m, Ar-H), 7.26–7.16 (4 H, m, Ar-H), 4.89 (2 H, d,  $J=13.9$  Hz, Ar-CH<sub>2</sub>), 4.08 (2 H, bs), 4.03 (2 H, d,  $J=13.5$  Hz, Ar-CH<sub>2</sub>), 3.77–3.74 (2 H, m, CH<sub>2</sub>), 3.58–3.54 (2 H, m, CH<sub>2</sub>), 3.50–3.45 (10 H, m, CH<sub>2</sub>), 3.38–3.35 (2 H, m, CH<sub>2</sub>), 3.07–3.03 (2 H, m, CH<sub>2</sub>)。

## 【0175】

<実施例 4: 4 級アンモニウム塩 (化合物 12) の合成>

## 【0176】

## 【化 35】



(12)

## 【0177】

上記化合物 6 の R 体 (140 mg, 0.2 mmol) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジエチルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 12 (R 体) (120 mg, 0.17 mmol) を 87% の収率で得た。

## 【0178】

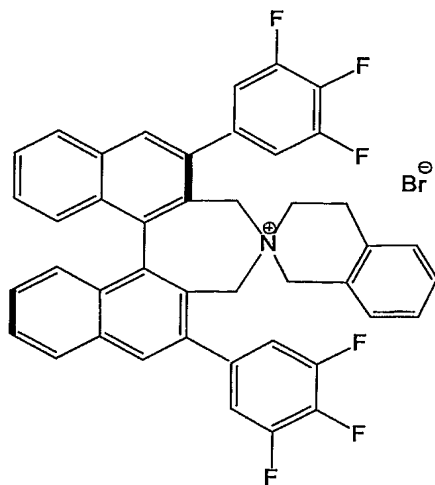
得られた化合物の NMR スペクトルは以下のとおりであった： $^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.02 (4H, bs, Ar-H), 7.67 (2H, t,  $J=7.5$  Hz, Ar-H), 7.41 (2H, t,  $J=7.7$  Hz, Ar-H), 7.35–7.27 (6H, m, Ar-H), 5.04 (2H, d,  $J=13.9$  Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.64 (2H, d,  $J=14.2$  Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.55–3.47 (2H, m, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_3$ ), 2.73 (2H, q,  $J=6.9$  Hz, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_3$ ), 0.64 (6H, t,  $J=6.9$  Hz,  $\text{CH}_3$ )。

## 【0179】

<実施例 5：4 級アンモニウム塩 (化合物 13) の合成>

## 【0180】

## 【化 3 6】



(13)

【 0 1 8 1 】

上記化合物 6 の R 体 (140 mg, 0.2 mmol) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりに 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 13 (117 mg, 0.16 mmol) を 78% の収率で得た。

【0 1 8 2】

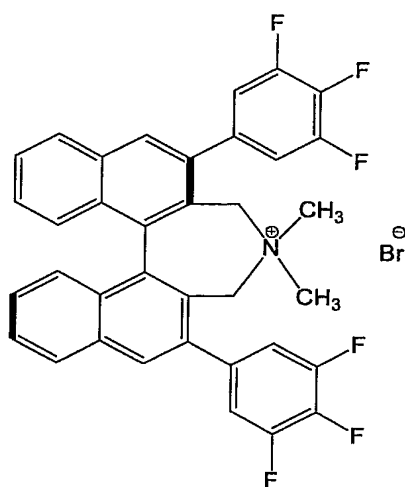
得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8.08–8.02 (4H, m, Ar-H), 7.71–7.63 (2H, m, Ar-H), 7.47–7.35 (4H, m, Ar-H), 7.26–7.14 (3H, m, Ar-H), 7.07 (2H, dd, J=7.5, 7.5 Hz, Ar-H), 6.99 (2H, d, J=7.5 Hz, Ar-H), 6.63 (1H, d, J=7.5 Hz, Ar-H), 5.45 (1H, d, J=15.0 Hz, N-CH<sub>2</sub>), 5.42 (1H, d, J=13.9 Hz, N-CH<sub>2</sub>), 4.83 (1H, d, J=12.7 Hz, N-CH<sub>2</sub>), 4.12 (1H, d, J=13.9 Hz, N-CH<sub>2</sub>), 3.94–3.86 (2H, m, N-CH<sub>2</sub>), 3.66 (1H, dd, J=11.7, 6.1 Hz), 3.36 (1H, dt, J=12.4, 5.3 Hz), 3.15–3.06 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J=18.2, 4.7 Hz, CH<sub>3</sub>)。

【 0 1 8 3 】

＜実施例 6：4 級アンモニウム塩（化合物 14）の合成＞

【 0 1 8 4 】

## 【化 37】



(14)

## 【0185】

上記化合物 6 の S 体 (140 mg, 0.2 mmol) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジメチルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 14 (117 mg, 0.18 mmol) を 88% の収率で得た。

## 【0186】

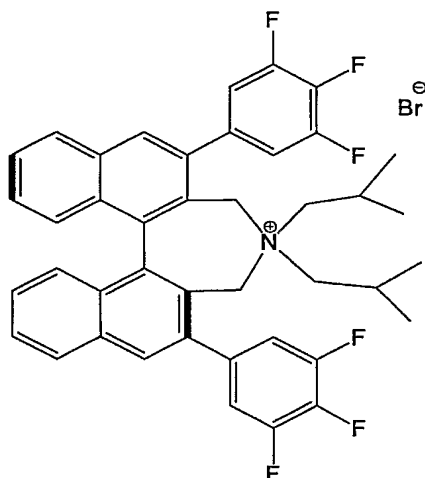
得られた化合物の NMR スペクトルは以下のとおりであった:  $^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.03–8.01 (4H, m, Ar-H), 7.64 (2H, t,  $J=7.3$  Hz, Ar-H), 7.41–7.35 (4H, m, Ar-H), 7.12 (4H, bs, Ar-H), 4.92 (2H, d,  $J=13.5$  Hz, Ar-CH<sub>2</sub>), 3.76 (2H, d,  $J=13.9$  Hz, Ar-CH<sub>2</sub>), 2.96 (6H, s, N-CH<sub>3</sub>)。

## 【0187】

<実施例 7: 4 級アンモニウム塩 (化合物 15) の合成>

## 【0188】

## 【化 38】



(15)

## 【0189】

上記化合物 6 の S 体 (140 mg, 0.2 mmol) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジイソブチルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 15 (137 mg, 0.18 mmol) を 91% の収率で得た。

## 【0190】

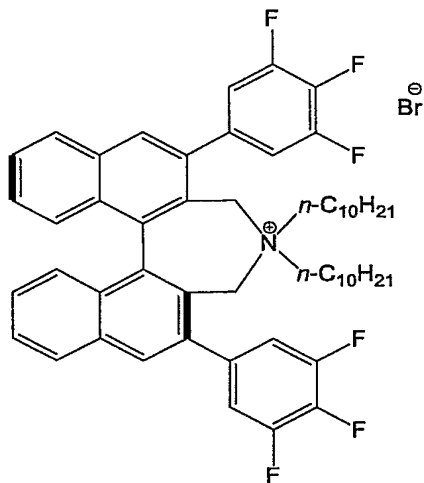
得られた化合物の NMR スペクトルは以下のとおりであった： $^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.00–7.96 (4 H, m, Ar–H), 7.58–7.54 (2 H, m, Ar–H), 7.34–7.21 (8 H, m, Ar–H), 4.54 (2 H, d,  $J=13.1$  Hz, Ar–CH<sub>2</sub>), 4.11 (2 H, d,  $J=13.4$  Hz, Ar–CH<sub>2</sub>), 3.08 (2 H, dd,  $J=13.3, 4.9$  Hz, N–CH<sub>2</sub>–CH), 2.39 (2 H, dd,  $J=13.4, 4.9$  Hz, N–CH<sub>2</sub>–CH), 2.00–1.93 (2 H, m, CH), 0.86 (2 H, d,  $J=6.3$  Hz, CH<sub>3</sub>), 0.76 (2 H, d,  $J=6.7$  Hz, CH<sub>3</sub>)。

## 【0191】

<実施例 8：4 級アンモニウム塩 (化合物 16) の合成>

## 【0192】

## 【化 39】



(16)

## 【0193】

上記化合物 6 の S 体 (140 mg, 0.2 mmol) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジ-n-デシルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 16 (117 mg, 0.13 mmol) を 64 % の収率で得た。

## 【0194】

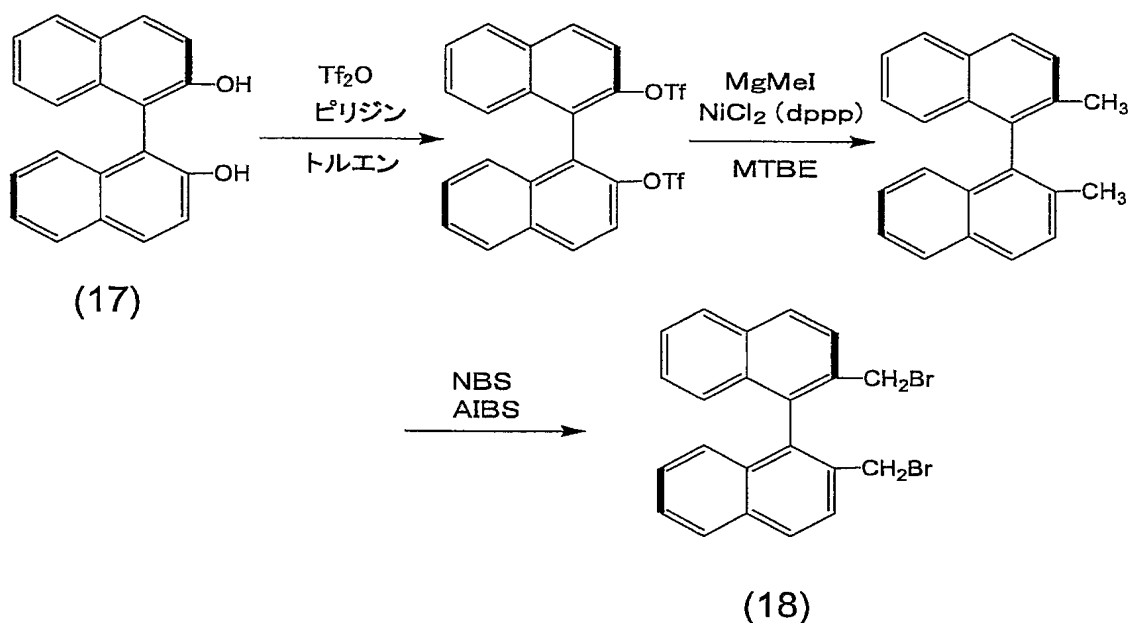
得られた化合物の NMR スペクトルは以下のとおりであった：<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7.98–7.97 (4 H, m, Ar–H), 7.57–7.53 (2 H, m, Ar–H), 7.32–7.27 (8 H, m, Ar–H), 4.96 (2 H, d, J=13.9 Hz, Ar–CH<sub>2</sub>), 3.76 (2 H, d, J=14.2 Hz, Ar–CH<sub>2</sub>), 3.22 (2 H, t, J=12.7 Hz, Ar–CH<sub>2</sub>), 2.78 (1 H, t, J=8.1 Hz, Ar–CH<sub>2</sub>), 2.60 (2 H, t, J=11.1 Hz, CH<sub>2</sub>), 1.80 (1 H, bs), 1.29–0.85 (34 H, m), 0.34 (2 H, m)。

## 【0195】

<参考例 2：4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 18) の合成>

## 【0196】

## 【化 40】



## 【0197】

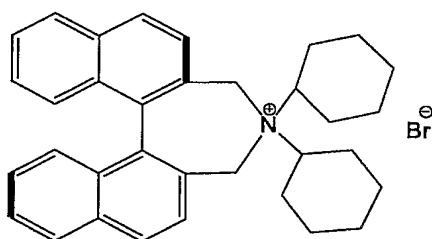
化合物 17 (R 体) と化合物 17 に対して 4 当量のピリジンとの混合物に、トルエン中 3 当量のトリフルオロメタンスルホン酸無水物 ( $\text{TiF}_2\text{O}$ ) を、40 分かけて窒素雰囲気中で 2 ~ 9 °C にて攪拌しながら滴下した。滴下終了後、得られた混合物を室温にて 3 時間攪拌した。この混合物に、ピリジン、水、および 35 % 塩酸を加えた後、有機層を回収し、トリフルリル化物を定量的に得た。次いで、tert-ブチルメチルエステル (MTBE) 中で、MeI (3 当量) を Mg (3 当量) 溶液に滴下し、これに  $\text{NiCl}_2(\text{dppp})$  (0.05 当量) を加え、さらに上記のトリフルリル化物を滴下して、55 °C にて加熱還流下で 30 分間攪拌した。得られた混合物にトルエンを加え、冷水中に注ぎ、塩酸を加えた後、有機層を回収し、ジメチル化物を 96.1 % の収率で得た。次いで、ジメチル化物に、シクロヘキサン中、N-ブロモスクシンイミド (NBS; 2.5 当量) および 2,2'-アゾビスイソブチロニトリル (AIBN; 0.05 当量) を室温にて加え、攪拌しながら 2 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷却した後、酢酸エチルを加えて攪拌し、水中に注いだ。2 層混合物を、沈殿が生じなくなるまで攪拌し、沈殿物を回収し、化合物 18 (R 体) を 54.3 % の収率で得た。

## 【0198】

<実施例 9: 4 級アンモニウム塩 (化合物 19) の合成>

## 【0199】

## 【化 4 1】



(19)

【 0 2 0 0 】

上記化合物 18 (R 体) (88 mg, 0.2 mmol) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジシクロヘキシルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 19 (54 mg, 0.10 mmol) を 50 % の収率で得た。

【0 2 0 1】

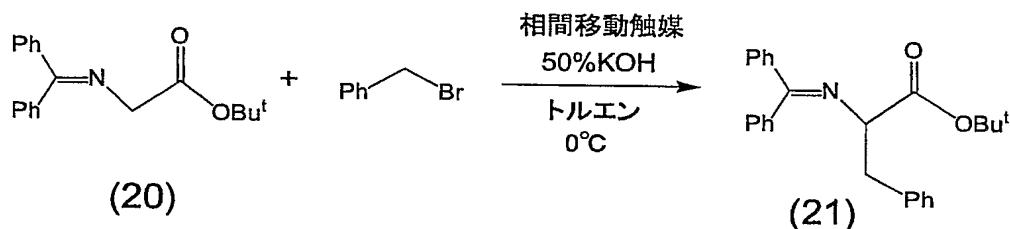
得られた化合物のNMRスペクトルは以下のとおりであった：<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8.12 (2H, d, J=8.3 Hz, Ar-H), 8.02 (2H, d, J=8.7 Hz, Ar-H), 7.90 (2H, d, J=8.3 Hz, Ar-H), 7.59 (2H, dd, J=7.6, 8.3 Hz, Ar-H), 7.42 (2H, d, J=8.7 Hz, Ar-H), 7.36 (2H, dd, J=7.6, 8.3 Hz, Ar-H), 5.40 (2H, d, J=12.7 Hz, Ar-CH<sub>2</sub>), 3.61 (2H, d, J=13.5 Hz, Ar-CH<sub>2</sub>), 3.36 (2H, t, J=11.9 Hz, CH<sub>2</sub>), 3.17 (2H, bs, CH<sub>2</sub>), 3.03 (2H, d, J=10.3 Hz, CH<sub>2</sub>), 2.47 (2H, d, J=11.1 Hz, CH<sub>2</sub>), 2.25-1.07 (14H, m)。

【 0 2 0 2 】

<実施例 10：種々の相間移動触媒による  $\alpha$ -ベンジル化反応>

【 0 2 0 3 】

【化 4 2】



【 0 2 0 4 】

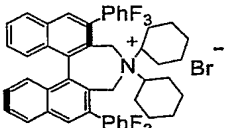
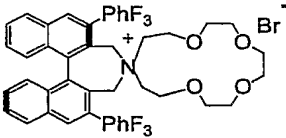
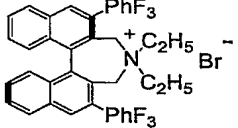
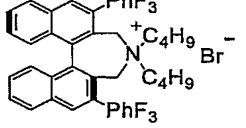
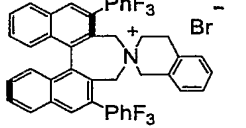
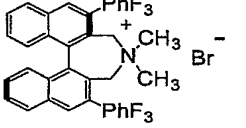
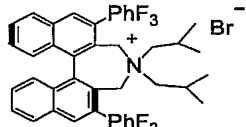
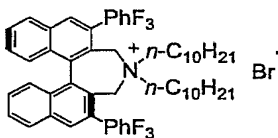
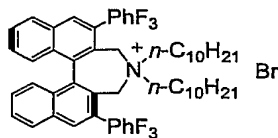
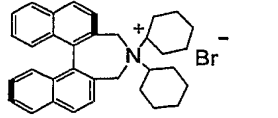
グリシンtert-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基（化合物20）（14.8mg, 0.5mmol）、化合物20に対して以下の表1に記載の量の相間移動触媒、



50%水酸化カリウム水溶液 (1.0 mL)、およびトルエン (3.0 mL) を混合して、臭化ベンジル (72.8  $\mu$ g, 0.5 mmol) を 0℃ にて滴下した。0℃ にてそれぞれ以下の表 1 に記載の時間攪拌した後、反応混合物を水に注ぎ、エーテルで抽出した。エーテル抽出物を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥して、減圧濃縮した。油状残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (エーテル/ヘキサン=1/10 で溶出) に付し、(S)-フェニルアラニン tert-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基 (化合物 21) を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLC にて分析した [Daicel Chiralcel OD; 溶離液: ヘキサン/2-プロパノール=100:1、0.5 mL/分; 保持時間: (R) 体=14.8 分、(S) 体=28.2 分]。

【0205】

【表 1】

相間移動触媒(使用量)	反応時間(時間)	収率(%)	光学純度(%ee)
 化合物10 (1mol%)	48	14	5
 化合物11 (1mol%)	20	94	87
 化合物12 (1mol%)	48	14	89
 化合物7 (3mol%)	21	86	97
 化合物13 (1mol%)	32	80	85
 化合物14 (3mol%)	54	63	14
 化合物15 (3mol%)	36	80	1
 化合物16 (1mol%)	48	20	98
 化合物16 (3mol%)	48	18	97
 化合物19 (3mol%)	7日	11	6

## 【0206】

<実施例 11:  $\alpha$ -ベンジル化反応の温度の影響の検討>

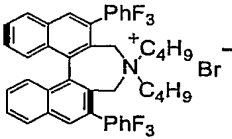
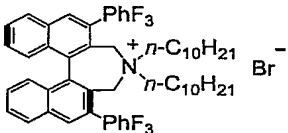
上記実施例 10 に準じて、相間移動触媒(化合物 7 (R) または化合物 16 (S)) を

出証特 2005-3018140

3 mol %用いて0℃または室温にて $\alpha$ -ベンジル化を行った。結果を表2に示す。

【0207】

【表2】

相間移動触媒	反応温度	反応時間 (時間)	収率 (%)	光学純度 (%ee)
 化合物7	0℃	21	86	97
	室温	3	95	71
 化合物16	0℃	48	18	97
	室温	1	91	92

【0208】

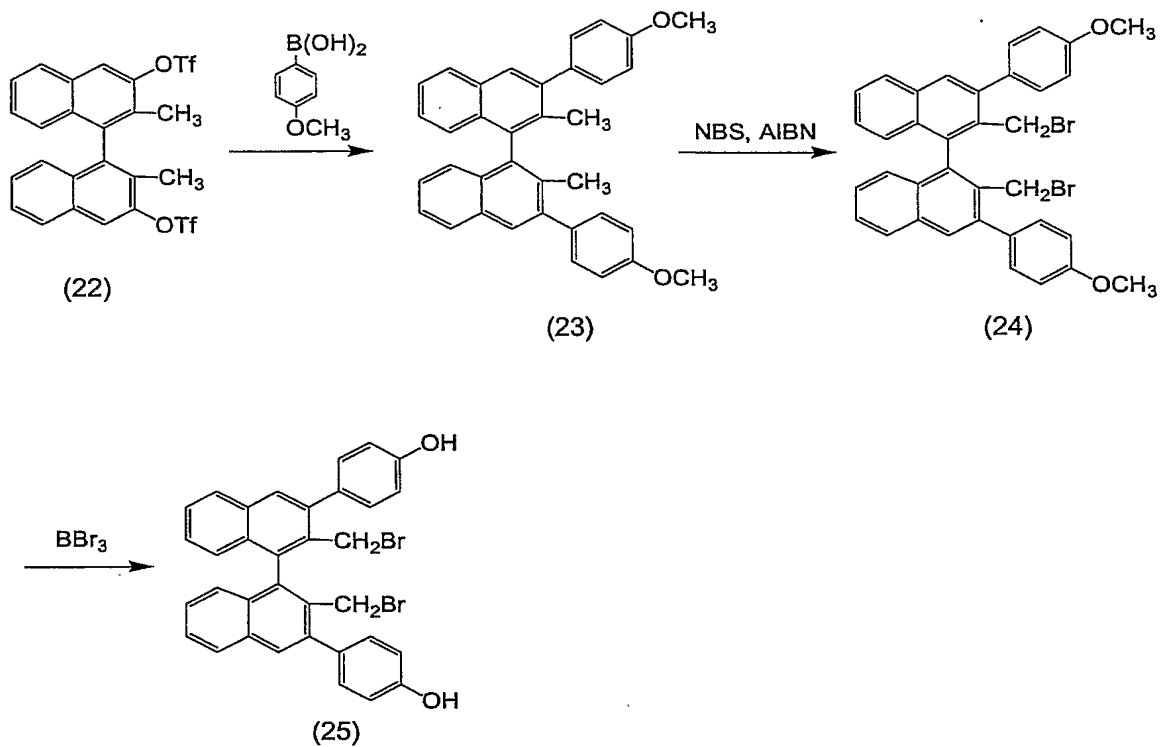
温度が高い場合は反応時間が短く収率もよいが、光学純度については低温の場合が良好な傾向が見られた。

【0209】

<参考例3: 4級アンモニウム塩の合成のための出発物質(化合物24および化合物25の合成)>

【0210】

## 【化 4 3】



## 【0211】

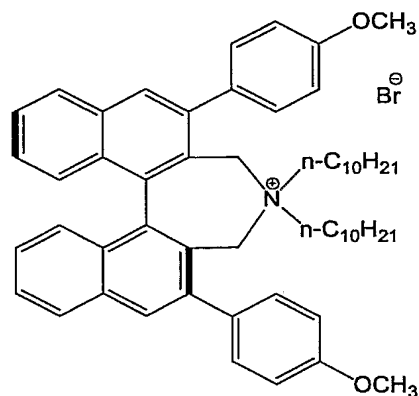
化合物 22 (S 体) と、化合物 22 (S 体) に対して 2 当量の 4-メトキシフェニルボロン酸との Suzuki のカップリング反応を行って、化合物 23 を良好な収率で得た。化合物 23 を、ベンゼン中 2.2 当量の N-ブロモスクシンイミド (NBS) および 0.1 当量の 2,2'-アゾビスイソブチロニトリル (AIBN) と加熱還流して、化合物 24 を良好な収率で得た。次いで、化合物 24 を、2.4 当量の  $\text{BBr}_3$  で処理して、化合物 25 を良好な収率で得た。なお、R 体についても、同様の手順により調製できる。

## 【0212】

<実施例 12: 4 級アンモニウム塩 (化合物 26) の合成>

## 【0213】

## 【化 4 4】



(26)

## 【0 2 1 4】

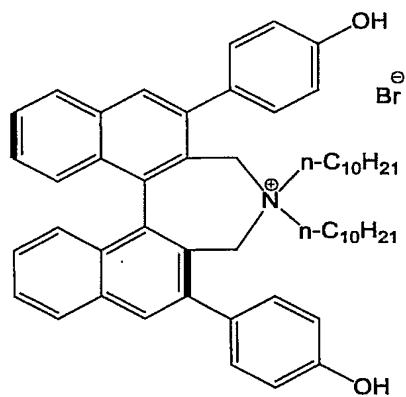
上記化合物 24 (S 体) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジ n-デシルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 26 を良好な収率で得た。

## 【0 2 1 5】

<実施例 13: 4 級アンモニウム塩 (化合物 27) の合成>

## 【0 2 1 6】

## 【化 4 5】



(27)

## 【0 2 1 7】

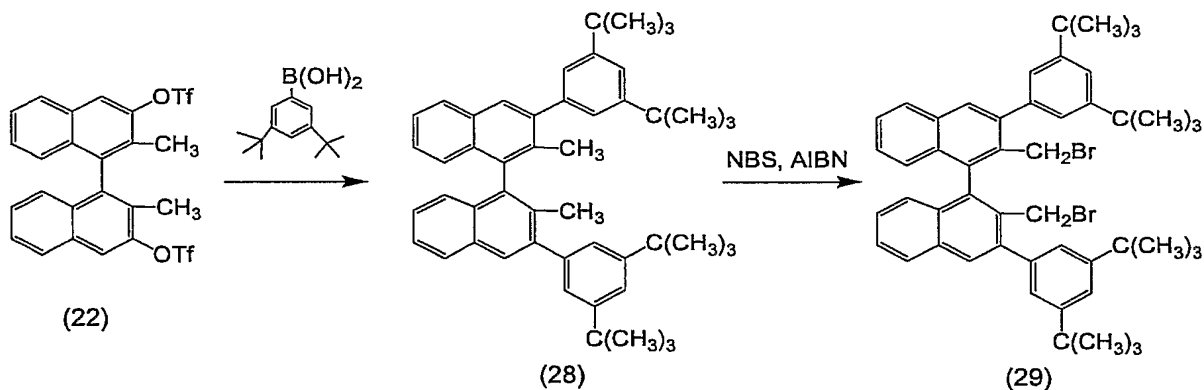
上記化合物 25 (S 体) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジ n-デシルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 27 を良好な収率で得た。

## 【0 2 1 8】

<参考例 4: 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 29 の合成)>

【0219】

【化46】



【0220】

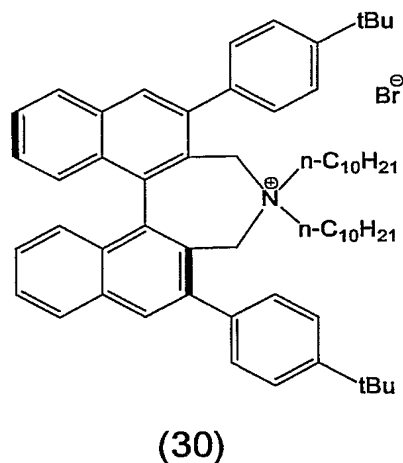
化合物 22 (S 体) と、化合物 22 に対して 2 当量の 3, 5-ジ-tert-ブチルフェニルボロン酸との Suzuki のカップリング反応を、水およびジメチルエーテル中、化合物 22 に対して 3 当量の水酸化バリウム 8 水和物、5 mol % の酢酸パラジウム、および 1.2 mol % のトリフェニルホスフィン中で 7 時間還流して行った。室温まで冷却した後、塩化アンモニウム飽和液を加え、エチルエーテルで抽出して、化合物 28 を 88 % の収率で得た。次いで、化合物 28 を、ベンゼン中 2 当量の NBS および 0.1 当量の AIBN を 1 時間還流し、濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにかけて、化合物 29 を 77 % の収率で得た。なお、R 体についても、同様の手順により調製できる。

【0221】

<実施例 14 : 4 級アンモニウム塩 (化合物 30) の合成>

【0222】

【化47】



【0223】

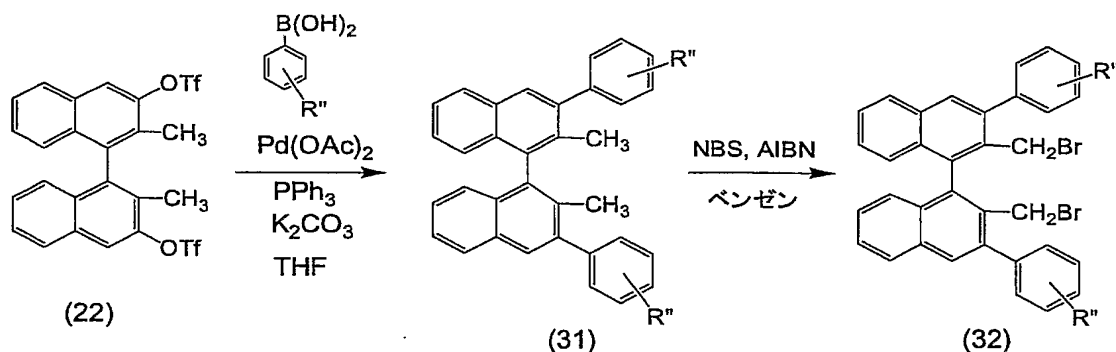
上記化合物 29 (S 体) を用いて、そしてジブチルアミンの代わりにジ-n-デシルアミンを用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、化合物 30 を良好な収率で得た。

【0224】

<参考例 5: 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 32) の合成>

【0225】

【化 48】



【0226】

(ここで、R'' は、p-フルオロ、m-フルオロ、3,4-ジフルオロ、3,4,5-トリフルオロ、p-クロロ、m-クロロ、3,4,5-トリクロロ、3,5-トリフルオロメチル、3,5-ジ-tert-ブチル、p-メトキシ、p-トリフルオロメトキシ、p-ヒドロキシ、3,5-ジフェニル、p-(3,4,5-トリフルオロフェニル)、p-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)、m-シアノ、または m-ニトロであり、2つの R'' は同一であっても異なってもよい)。

【0227】

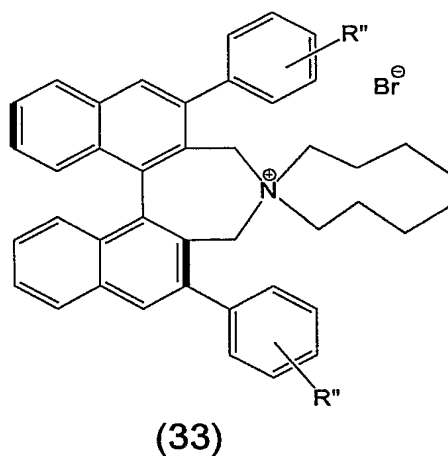
化合物 22 (S 体) と、化合物 22 に対して 2 当量のアリールボロン酸誘導体との Suzuki のカップリング反応を、テトラヒドロフラン中、3 当量の水酸化カリウムまたはリン酸カリウム、5 mol % の酢酸パラジウム、および 1.2 mol % のトリフェニルホスフィン中で 7 時間還流して行った。室温まで冷却した後、塩化アンモニウム飽和液を加え、エチルエーテルで抽出して、化合物 31 を 87 % の収率で得た。次いで、化合物 31 を、ベンゼン中 2 当量の N-ブロモスクシンイミドおよび 0.1 当量の 2,2'-アゾビスイソブチロニトリルを 1 時間還流し、濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにかけて、化合物 32 を 97 % の収率で得た。なお、R 体についても、同様の手順により調製できる。

【0228】

<実施例 15: 4 級アンモニウム塩 (化合物 33) の合成>

【0229】

## 【化 4 9】

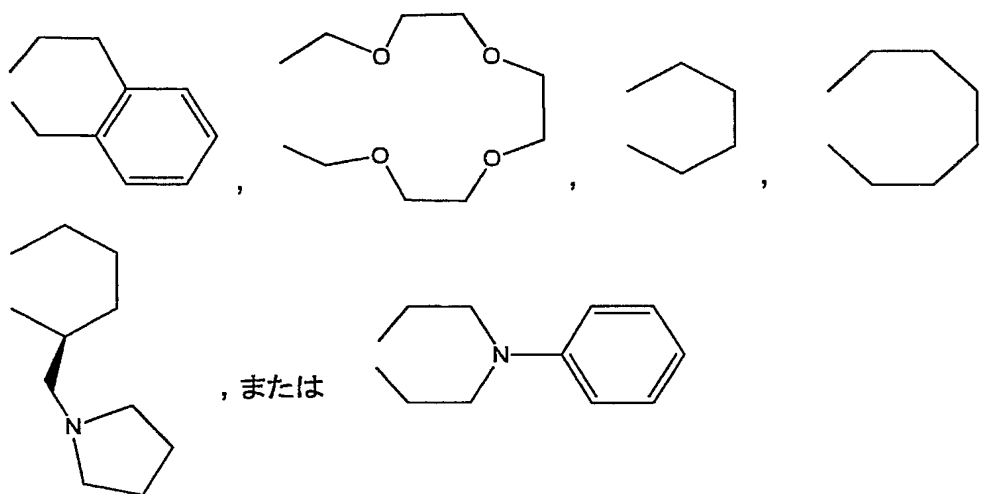


## 【0 2 3 0】

上記化合物 3 2 (S 体) を用いて、そして上記実施例 1 のジブチルアミンの代わりにジアミン  $R^7-NH-R^8$  (ここで、 $R^7$  および  $R^8$  は、同一であって、メチル、*n*-ブチル、イソブチル、1-ヒドロキシエチル、1-メトキシエチル、*n*-デシル、シクロヘキシル、または 1-プロピニルであるか、あるいは  $R^7$  および  $R^8$  が一緒になって、

## 【0 2 3 1】

## 【化 5 0】



## 【0 2 3 2】

である) を用いて、上記実施例 1 と同様の手順を行った。シリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して精製し、それぞれ良好な収率で化合物 3 3 を得た。なお、R 体についても、同様の手順により調製できる。

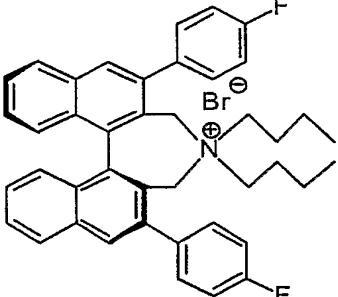
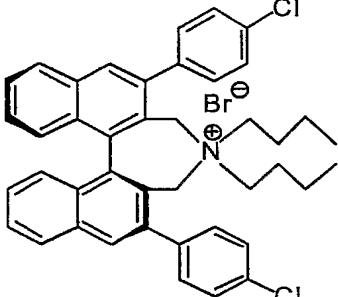
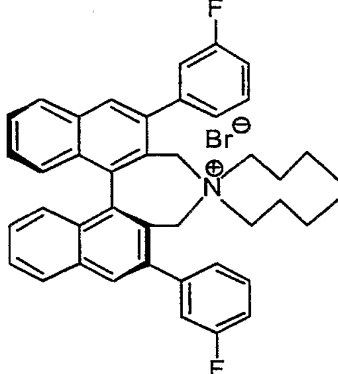
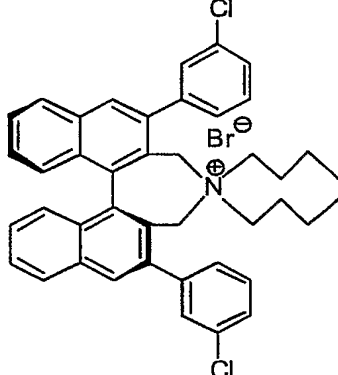
## 【0 2 3 3】

得られた具体的な化合物について、その構造式および NMR スペクトルデータを表 3 ~ 7 に示す。



【0234】

【表3】

	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.05 (2H, s, Ar-H), 8.02 (2H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 7.63 (2H, dd, <i>J</i> = 7.3, 7.3 Hz, Ar-H), 7.58 (4H, brs, Ar-H), 7.40-7.29 (8H, m, Ar-H), 5.09 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.66 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.21 (2H, t, <i>J</i> = 12.9 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 2.55 (2H, dt, <i>J</i> = 4.0, 12.9 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 1.01-0.98 (4H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.92-0.85 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.67 (6H, t, <i>J</i> = 6.9 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.23-0.20 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -)
	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.03 (2H, s, Ar-H), 8.00 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 7.61 (2H, dd, <i>J</i> = 6.7, 6.7 Hz, Ar-H), 7.54 (8H, brs, Ar-H), 7.37-7.29 (4H, m, Ar-H), 5.03 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.64 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.14 (2H, t, <i>J</i> = 13.0 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 2.52 (2H, dt, <i>J</i> = 4.4, 13.0 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 0.98-0.96 (4H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.84-0.82 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.65 (6H, t, <i>J</i> = 6.9 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.20-0.15 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -)
	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.02 (2H, s, Ar-H), 7.98 (2H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 7.60-7.57 (4H, m, Ar-H), 7.35-7.28 (8H, m, Ar-H), 7.12 (2H, dd, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 5.03 (2H, br, N-CH <sub>2</sub> -), 3.61 (2H, d, <i>J</i> = 12.7 Hz, N-CH <sub>2</sub> -), 3.15 (2H, br, N-CH <sub>2</sub> -), 2.51 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 0.95-0.89 (6H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.61 (6H, t, <i>J</i> = 6.1 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.13 (2H, brs, -CH <sub>2</sub> -)
	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.03(2H, s, Ar-H), 8.00 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 7.61 (2H, dd, <i>J</i> = 7.3 Hz, Ar-H), 7.56 (4H, brs, Ar-H), 7.43 (2H, d, <i>J</i> = 7.5 Hz, Ar-H), 7.37-7.29 (6H, m, Ar-H), 5.05 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 3.60 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 3.19 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 2.51 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 0.97-0.84 (6H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.65 (6H, t, <i>J</i> = 6.7 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.15 (2H, brs, -CH <sub>2</sub> -)

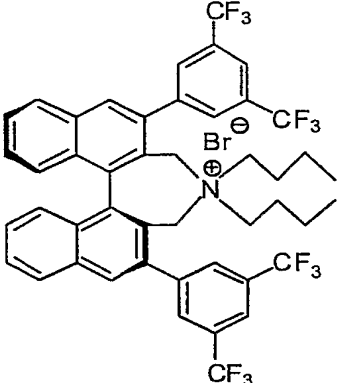
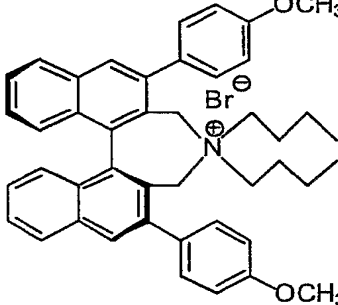
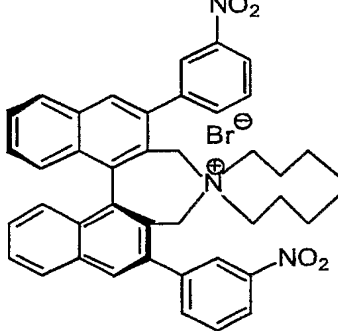
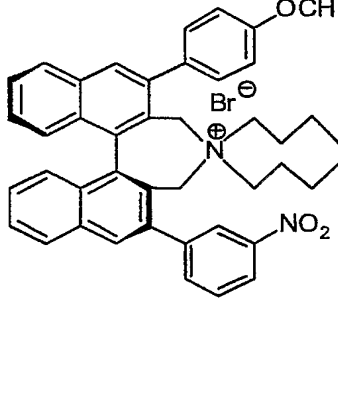
【0235】

【表 4】

	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.05 (2H, s, Ar-H), 8.05 (2H, d, <i>J</i> = 8.0 Hz, Ar-H), 7.73-7.63 (6H, m, Ar-H), 7.42 (2H, dd, <i>J</i> = 8.3, 8.3 Hz, Ar-H), 7.33 (2H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 4.99 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.78 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.34 (2H, t, <i>J</i> = 13.5 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 2.67 (2H, dt, <i>J</i> = 4.7, 13.1 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 1.13-1.11 (4H, m, -CH <sub>2</sub> -), 1.03-0.99 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.73 (6H, t, <i>J</i> = 7.5 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.39-0.35 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -)
	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.06 (2H, s, Ar-H), 8.03 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 7.66-7.62 (6H, m, Ar-H), 7.45-7.32 (8H, m, Ar-H), 5.07 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.70 (2H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.20 (2H, t, <i>J</i> = 12.5 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 2.57 (2H, t, <i>J</i> = 12.9 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 0.98-0.95 (4H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.90-0.87 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.65 (6H, t, <i>J</i> = 6.9 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.25-0.21 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -)
	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.21 (2H, s, Ar-H), 8.08 (2H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 7.99 (2H, s, Ar-H), 7.94 (2H, s, Ar-H), 7.82-7.78 (8H, m, Ar-H), 7.69-7.62 (4H, m, Ar-H), 7.53-7.33 (16H, m, Ar-H), 5.15 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.87 (2H, d, <i>J</i> = 13.7 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.24 (2H, t, <i>J</i> = 12.5 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 2.77 (2H, dt, <i>J</i> = 4.4, 12.7 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 1.00-0.95 (4H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.82-0.78 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.47-0.44 (8H, m, -CH <sub>2</sub> -, -CH <sub>3</sub> )
	<sup>1</sup> H NMR(400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 65 °C) δ 8.07-7.99 (6H, m, Ar-H), 7.82-7.77 (6H, m, Ar-H), 7.67 (2H, dd, <i>J</i> = 7.7, 7.7 Hz, Ar-H), 7.41 (2H, dd, <i>J</i> = 7.7, 7.7 Hz, Ar-H), 7.33 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 5.01 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> ), 3.76-3.74 (2H, m, N-CH <sub>2</sub> -), 3.31 (2H, br, N-CH <sub>2</sub> ), 2.56 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 1.05 (4H, brs, -CH <sub>2</sub> -), 0.93-0.92 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.69 (6H, t, <i>J</i> = 7.1 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.24 (2H, brs, -CH <sub>2</sub> -)

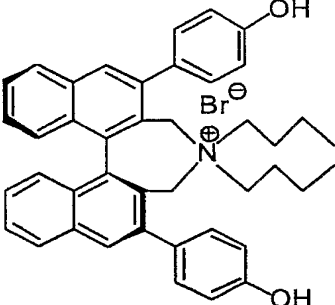
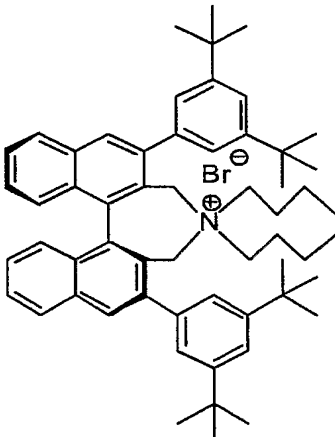
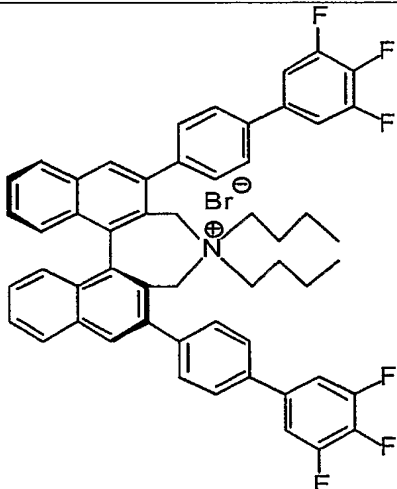
【0236】

【表 5】

	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.22 (2H, brs, Ar-H), 8.10-8.05 (8H, m, Ar-H), 7.73-7.69 (2H, m, Ar-H), 7.48-7.44 (2H, m, Ar-H), 7.40-7.38 (2H, m, Ar-H), 4.83 (2H, d, <i>J</i> = 14.3 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 4.03 (2H, d, <i>J</i> = 14.3 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.37 (2H, t, <i>J</i> = 13.1 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 2.65 (2H, t, <i>J</i> = 12.9 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 1.10 (4H, brs, -CH <sub>2</sub> -), 0.87 (2H, brs, -CH <sub>2</sub> -), 0.63 (6H, t, <i>J</i> = 6.7 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.32 (2H, brs, -CH <sub>2</sub> -)
	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8.01 (2H, s, Ar-H), 7.97 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 7.60-7.56 (2H, m, Ar-H), 7.46 (4H, brs, Ar-H), 7.32-7.31 (4H, m, Ar-H), 7.08 (4H, d, <i>J</i> = 8.0 Hz, Ar-H), 5.05 (2H, d, <i>J</i> = 13.5 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.84 (6H, s, -OCH <sub>3</sub> ), 3.57 (2H, d, <i>J</i> = 13.5 Hz, Ar-CH <sub>2</sub> ), 3.03 (2H, t, <i>J</i> = 13.1 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 2.52 (2H, dt, <i>J</i> = 4.0, 12.3 Hz, N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -), 0.94-0.87 (6H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.62 (6H, t, <i>J</i> = 6.9 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.21-0.17 (2H, brs, -CH <sub>2</sub> -)
	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 65 °C) δ 8.34 (2H, s, Ar-H), 8.33 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 8.12 (2H, s, Ar-H), 8.10-8.06 (4H, m, Ar-H), 7.90 (2H, dd, <i>J</i> = 7.7, 7.7 Hz, Ar-H), 7.68 (2H, dd, <i>J</i> = 7.1, 7.1 Hz, Ar-H), 7.43 (2H, dd, <i>J</i> = 7.3, 7.3 Hz, Ar-H), 7.36 (2H, d, <i>J</i> = 8.7 Hz, Ar-H), 5.05 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 3.78 (2H, d, <i>J</i> = 13.1 Hz, N-CH <sub>2</sub> -), 3.35 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 2.56 (2H, t, <i>J</i> = 12.7 Hz, N-CH <sub>2</sub> -), 1.01-0.99 (4H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.82-0.80 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -), 0.58 (6H, t, <i>J</i> = 7.5 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.22 (2H, brs, -CH <sub>2</sub> -)
	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> , 65 °C) δ 8.37 (1H, s, Ar-H), 8.32 (1H, d, <i>J</i> = 8.3 Hz, Ar-H), 8.24 (1H, d, <i>J</i> = 7.5 Hz, Ar-H), 8.12 (1H, s, Ar-H), 8.08-7.96 (4H, m, Ar-H), 7.68-7.61 (2H, m, Ar-H), 7.43-7.30 (6H, m, Ar-H), 7.09 (2H, d, <i>J</i> = 7.9 Hz, Ar-H), 5.26 (1H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 4.96 (1H, d, <i>J</i> = 12.3 Hz, N-CH <sub>2</sub> -), 3.88 (3H, s, -OCH <sub>3</sub> ), 3.78 (1H, d, <i>J</i> = 13.9 Hz, N-CH <sub>2</sub> -), 3.59 (2H, d, <i>J</i> = 12.3 Hz, N-CH <sub>2</sub> -), 2.82-2.78 (1H, m, N-CH <sub>2</sub> -), 2.57 (2H, brs, N-CH <sub>2</sub> -), 1.08 (2H, brs, -CH <sub>2</sub> -), 0.93 (4H, brs, -CH <sub>2</sub> -), 0.66 (3H, t, <i>J</i> = 6.1 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.58 (3H, t, <i>J</i> = 7.2 Hz, -CH <sub>3</sub> ), 0.32-0.24 (2H, m, -CH <sub>2</sub> -)

【0237】

【表 6】

	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CD}_3\text{OD}$ ) $\delta$ 8.12 (2H, s, Ar-H), 8.09 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.64-7.60 (2H, m, Ar-H), 7.51-7.22 (8H, m, Ar-H), 6.96 (4H, brs, Ar-H), 4.86 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.58 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 2.74 (2H, t, $J = 12.7$ Hz, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_2$ -), 2.55 (2H, brs, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_2$ -), 1.00-0.95 (6H, m, - $\text{CH}_2$ -), 0.71 (6H, t, $J = 6.3$ Hz, - $\text{CH}_3$ ), 0.23 (2H, brs, - $\text{CH}_2$ -)
	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8.09 (2H, s, Ar-H), 8.06 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.66-7.62 (2H, m, Ar-H), 7.57 (2H, s, Ar-H), 7.47 (2H, s, Ar-H), 7.42-7.37 (4H, m, Ar-H), 7.21 (2H, s, Ar-H), 5.09 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.79 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.16 (2H, t, $J = 13.1$ Hz, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_2$ -), 2.52 (2H, t, $J = 6.0, 13.3$ Hz, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_2$ -), 1.42 (18H, s, - $\text{CH}_3$ ), 1.37 (18H, s, - $\text{CH}_3$ ), 1.05-1.02 (4H, brs, - $\text{CH}_2$ -), 0.84-0.82 (2H, brs, - $\text{CH}_2$ -), 0.62 (6H, t, $J = 6.9$ Hz, - $\text{CH}_3$ ), 0.53-0.49 (2H, brs, - $\text{CH}_2$ -)
	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8.12 (2H, s, Ar-H), 8.05 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.74-7.64 (10H, m, Ar-H), 7.42-7.36 (4H, m, Ar-H), 7.30-7.26 (4H, m, Ar-H), 5.20 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.68 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.26 (2H, t, $J = 12.7$ Hz, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_2$ -), 2.56 (2H, dt, $J = 4.0, 12.7$ Hz, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_2$ -), 0.98-0.96 (4H, m, - $\text{CH}_2$ -), 0.87-0.82 (2H, m, - $\text{CH}_2$ -), 0.53 (6H, t, $J = 6.9$ Hz, - $\text{CH}_3$ ), 0.26-0.23 (2H, m, - $\text{CH}_2$ -)

【0238】

【表 7】

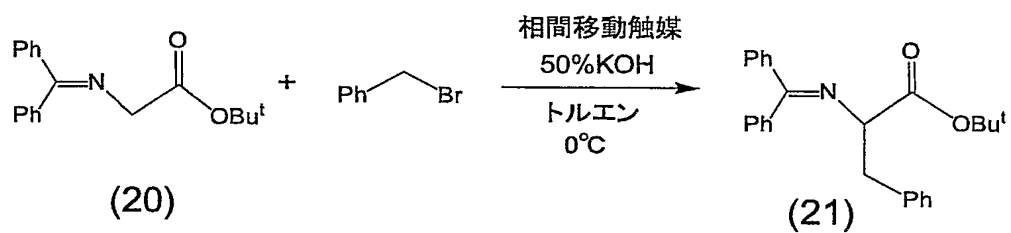
	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8.15 (2H, s, Ar-H), 8.07 (2H, d, $J = 7.9$ Hz, Ar-H), 7.76 (4H, brs, Ar-H), 7.70-7.65 (6H, m, Ar-H); 7.44-7.33 (4H, m, Ar-H), 5.21 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.75 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.29 (2H, t, $J = 12.7$ Hz, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_2$ -), 2.66-2.59 (2H, m, N- $\text{CH}_2$ - $\text{CH}_2$ -), 1.01-0.95 (6H, m, $-\text{CH}_2$ -), 0.62 (6H, t, $J = 6.7$ Hz, $-\text{CH}_3$ ), 0.38 (2H, brs, $-\text{CH}_2$ -)
	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.98-7.96 (4H, m, Ar-H), 7.60-7.56 (2H, m, Ar-H), 7.34 (4H, brs, Ar-H), 7.26 (4H, br, Ar-H), 7.11 (2H, dd, $J = 7.7, 7.7$ Hz, Ar-H), 6.82 (1H, dd, $J = 7.5, 7.5$ Hz, Ar-H), 6.59 (2H, d, $J = 7.9$ Hz, Ar-H), 4.92 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ -), 3.97 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ -), 3.84-3.79 (2H, m, $-\text{CH}_2$ -), 3.14-3.09 (2H, m, $-\text{CH}_2$ -), 2.99-2.95 (2H, m, $-\text{CH}_2$ -), 2.54-2.49 (2H, m, $-\text{CH}_2$ -)
	$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 8.05 (2H, s, Ar-H), 8.03 (2H, d, $J = 8.3$ Hz, Ar-H), 7.64 (2H, dd, $J = 7.5, 7.5$ Hz, Ar-H), 7.41-7.33 (4H, m, Ar-H), 7.26 (4H, br, Ar-H), 4.99 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 4.01 (2H, d, $J = 13.5$ Hz, Ar- $\text{CH}_2$ ), 3.57-3.54 (6H, m, $-\text{CH}_2$ -), 3.11 (6H, s, $-\text{OCH}_3$ ), 3.07 (2H, d, $J = 9.2$ Hz, $-\text{CH}_2$ -)

【0239】

&lt;実施例 16 : 相間移動触媒の置換基の影響の検討&gt;

【0240】

【化 5 1】



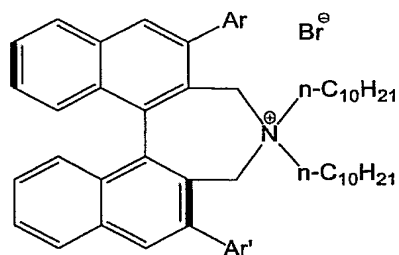
【0241】

上記実施例10に準じて、以下の表8から表10に記載の相間移動触媒を3mol%用いて0℃にて $\alpha$ -ベンジル化を行った。結果を表8から表10に示す。

【0242】

【表 8】

相間移動触媒:

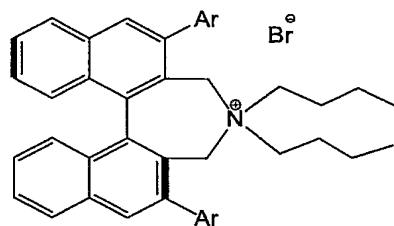


Ar	Ar'	反応時間 (時間)	収率 (%)	光学純度 (%ee)
		1.5	65	65
		1.5	88	87
		2	65	80
		24	86	58
		1	70	64
		4	87	66

【0243】

【表 9】

相間移動触媒:



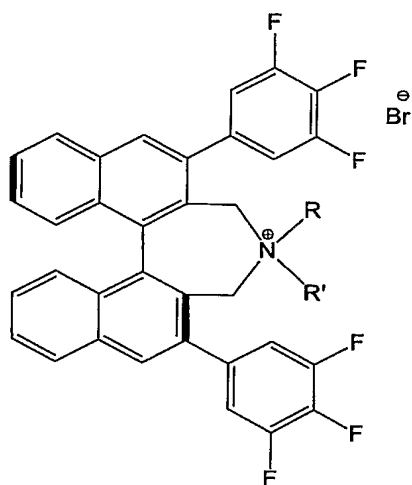
Ar	反応時間(時間)	収率(%)	光学純度(%ee)
	7	92	82
	7	93	83
	2	97	77
	4	94	75
	21	86	97
	3	62	93
	5	97	91
	3	85	71
	3	89	89

【0244】



【表 10】

相間移動触媒:



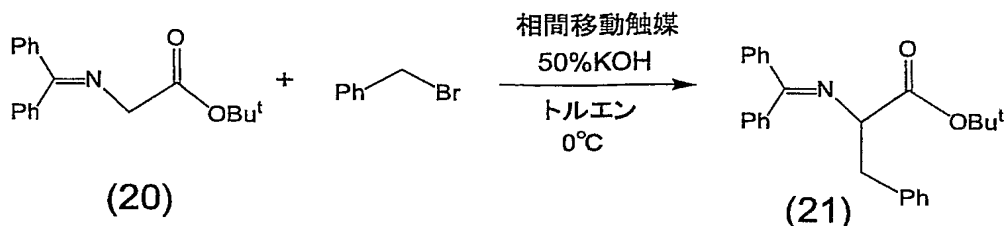
	反応時間(時間)	収率(%)	光学純度(%ee)
	7	98	93
	1	78	81
	2	55	78

【0245】

&lt;実施例 17: 攪拌の影響の検討&gt;

【0246】

## 【化52】



## 【0247】

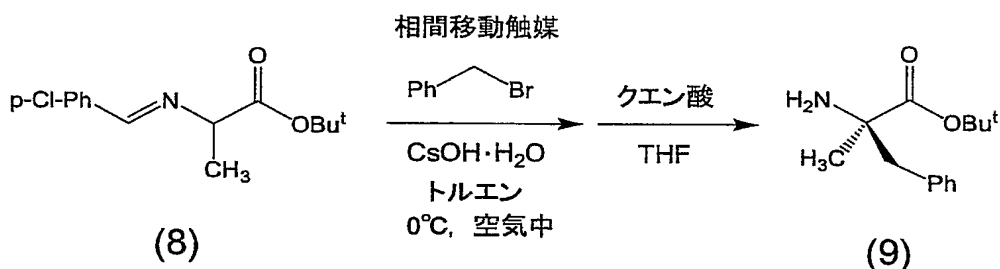
上記実施例10に準じて、相間移動触媒として化合物16 (S体) を3mol%用い、0℃にて1時間、より強力な攪拌子による攪拌下でベンジル化を行った。1時間の反応時間にもかかわらず、反応混合物のHPLC分析による収率は78%、そしてシリカゲルカラムでの精製後の収率は72%であり、光学純度は99% eeであった。これは、上記表1に示す結果よりも反応時間が非常に短かつ収率も高いことから、より強く攪拌することによって非常に反応効率がよくなることがわかる。

## 【0248】

<実施例18：アラニンのベンジル化(1)>


## 【0249】

## 【化53】



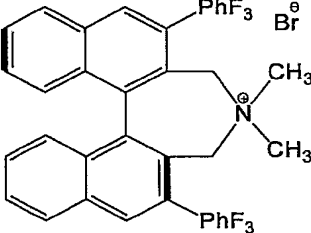
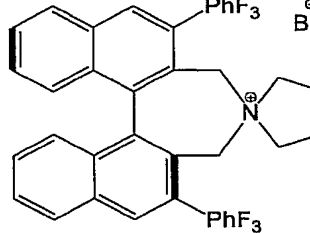
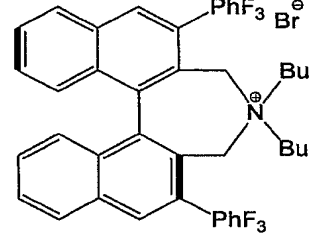
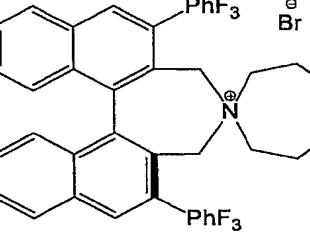
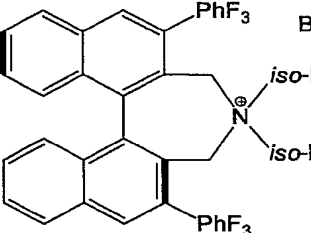
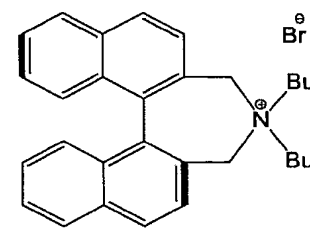
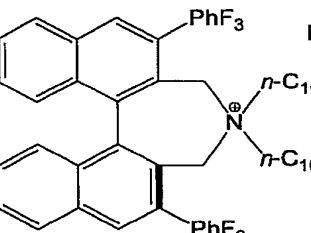
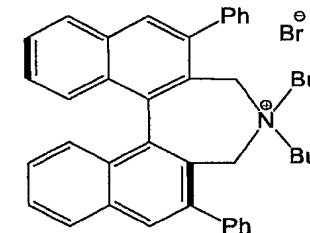
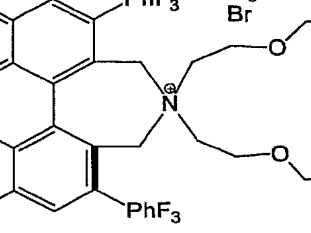
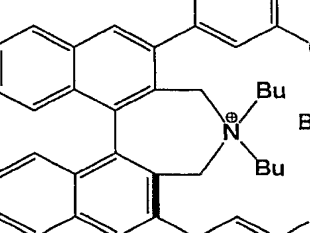
## 【0250】

トルエン2mL中のアラニンtert-ブチルエステル-p-クロロベンジルシッフ塩基(化合物8)(134mg, 0.5mmol)、以下の表6に記載の相間移動触媒(3mol%)、および臭化ベンジル(1.2当量)の混合物に、水酸化セシウム・一水和物(5当量)を0℃に加え、空気雰囲気下で0℃にて30分間攪拌した(第1工程)。反応混合物を水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出し、溶媒を留去して、テトラヒドロフラン5mLに溶解した。0.5Mクエン酸水溶液5mLを添加し、室温にて1時間攪拌した(第2工程)。水層をエーテルで洗浄し、炭酸水素ナトリウムでアルカリ性とした後、ジクロロメタンで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して、油状物を得た。得られた油状物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液:酢酸エチル/ヘキサン=2/1)にかけ、アラニンのベンジル化生成物(化合物9)を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した[Dai-Cell Chiral-Cell AD; 溶離液:ヘキサン/イソプロパノール=30:1、0.5mL/分; 保持時間:(R)体=12.9分、(S)体=20.5分]。収率および光学純度を表11に示す。



【 0 2 5 1 】

【表 11】

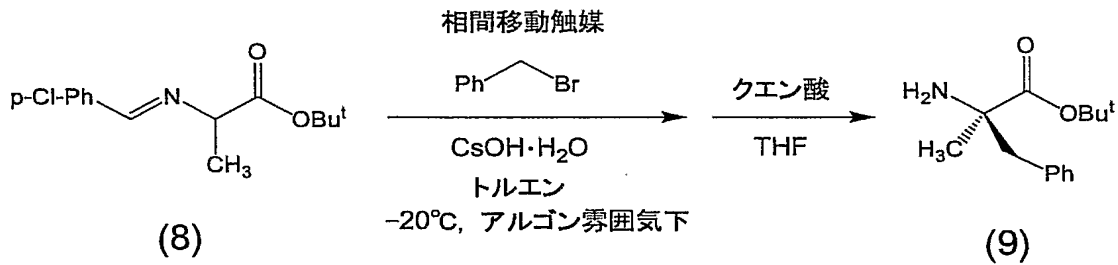
相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)	相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)
	58	63		72	49
	76	97		71	80
	65	54		65	95
	65	95		70	61
	72	82		70	94

【0252】

&lt;実施例19: アラニンのベンジル化(2)&gt;

【0253】

【化54】



【0254】

第1工程において、相間移動触媒を1mol%とし、以下の表7に記載の相間移動触媒を用い、そして反応条件をアルゴン雰囲気下-20℃としたこと以外は、上記実施例18と同様にアラニンのベンジル化を行った。結果を表12に示す。

【0255】

【表 12】

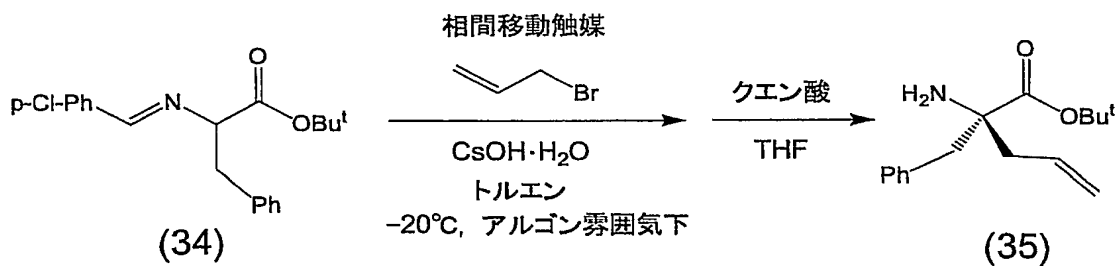
相間移動触媒	収率 (%)	光学純度 (%ee)	相間移動触媒	収率 (%)	光学純度 (%ee)
	78	85		78	98
	85	99		71	67
	76	73		85	92

【0256】

&lt;実施例 20: フェニルアラニンのアリル化&gt;

【0257】

【化 55】



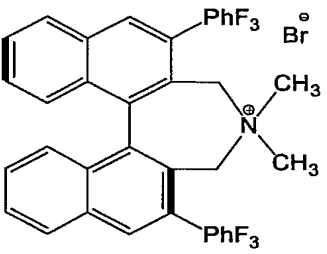
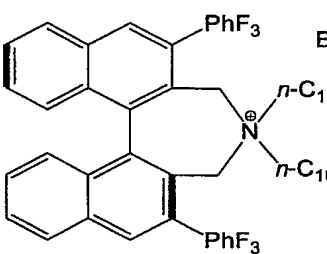
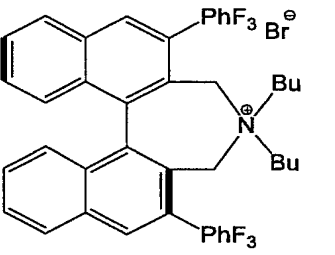
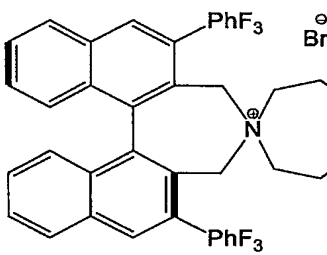
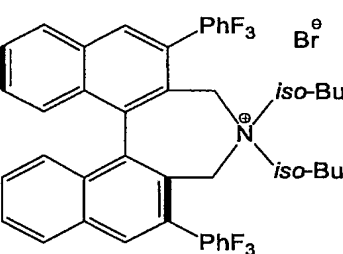
【0258】

トルエン 2 mL 中のフェニルアラニン *tert*-ブチルエステル-*p*-クロロベンジルシッフ塩基 (化合物 34) (172 mg, 0.5 mmol)、以下の表 8 に記載の相間移

動触媒（1モル%）、および臭化アリル（1.2当量）の混合物に、水酸化セシウム・一水和物（5当量）を0℃で加え、アルゴン雰囲気下で-20℃にて30分間攪拌した（第1工程）。反応混合物を水に注ぎ、ジクロロメタンで抽出し、溶媒を留去して、テトラヒドロフラン5mLに溶解した。0.5Mクエン酸水溶液5mLを添加し、室温にて1時間攪拌した（第2工程）。水層をエーテルで洗浄し、炭酸水素ナトリウムでアルカリ性とした後、ジクロロメタンで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して、油状物を得た。得られた油状物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液：酢酸エチル／ヘキサン＝1／2）にかけ、フェニルアラニンのアリル化生成物（化合物35）を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した〔Daicel Chiralpak AD；溶離液：ヘキサン／イソプロパノール＝100：1、0.5mL／分；保持時間：（R）体＝14.9分、（S）体＝20.2分〕。結果を表13に示す。

【0259】

【表13】

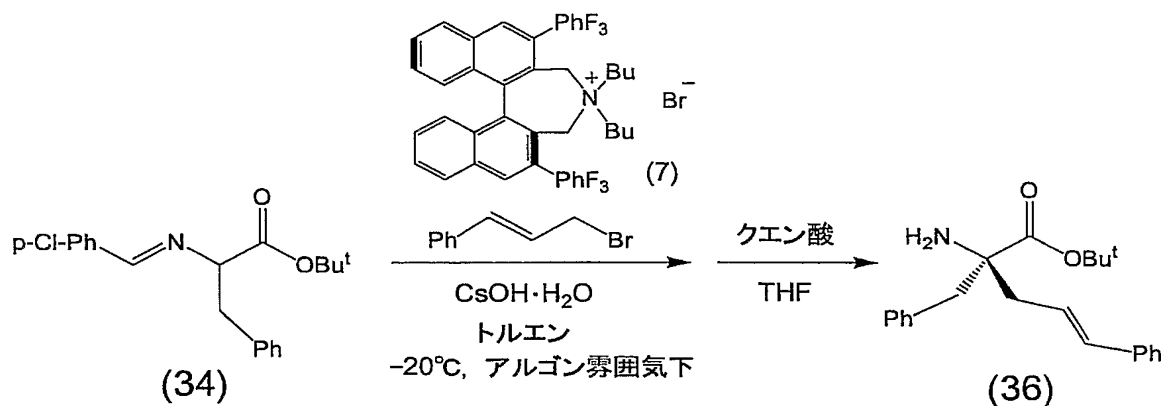
相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)	相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)
	65	70		79	95
	76	97		72	96
	76	74			

【0260】

&lt;実施例21：フェニルアラニンのシンナミル化&gt;

【0261】

## 【化 5 6】



## 【0262】

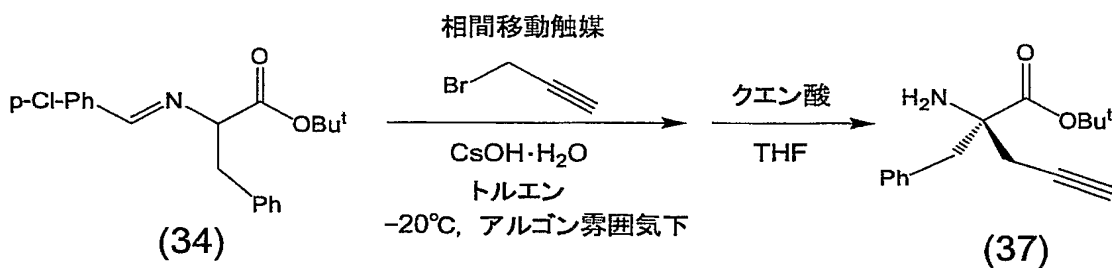
第1工程において、臭化アリルの代わりに臭化シンナミルを用い、相間移動触媒として化合物7を用いたこと以外は、上記実施例20と同様にして、フェニルアラニンのシンナミル化生成物（化合物36）を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した。収率は69%であり、光学純度は92% eeであった。

## 【0263】

<実施例22：フェニルアラニンのプロパルギル化>

## 【0264】

## 【化 5 7】



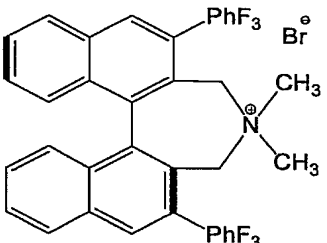
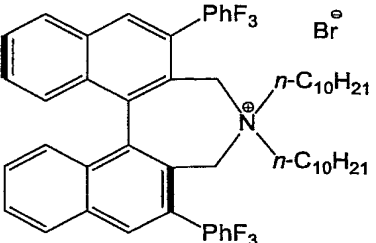
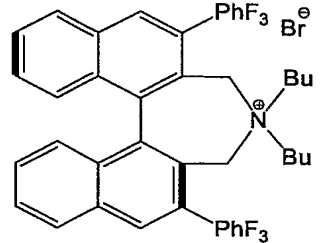
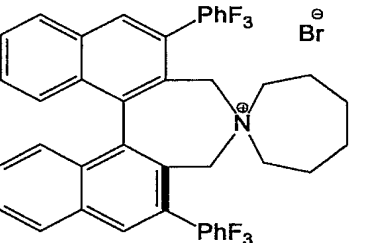
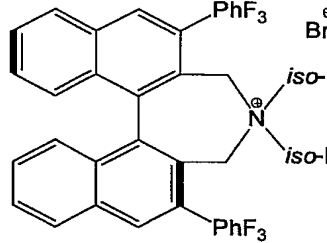
## 【0265】

第1工程において、臭化アリルの代わりに臭化プロパルギルを用いたこと以外は、上記実施例20と同様にして、フェニルアラニンのシンナミル化生成物（化合物37）を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した。結果を表14に示す。

## 【0266】



【表 14】

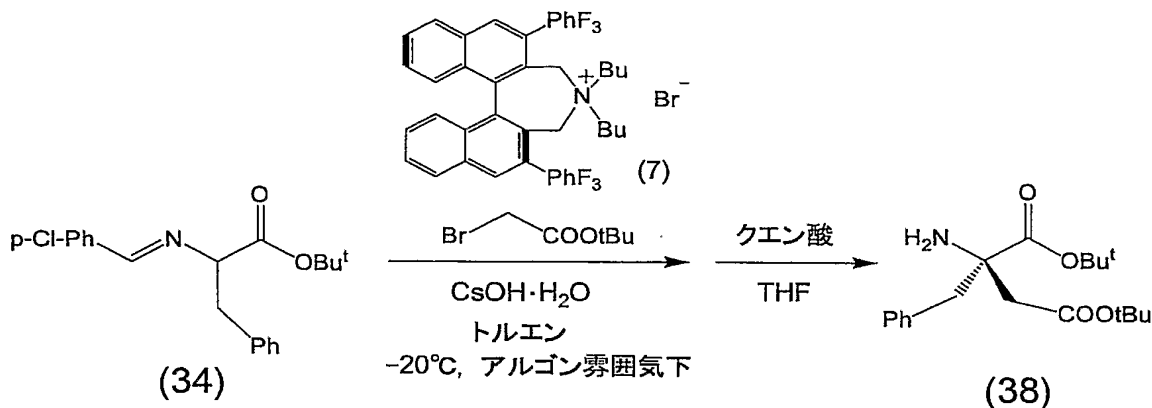
相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)	相間移動触媒	収率 (%)	光学 純度 (%ee)
	79	63		77	91
	61	94		77	92
	67	62			

【0267】

&lt;実施例 23：フェニルアラニンのtert-ブトキシカルボニルメチル化&gt;

【0268】

## 【化58】



## 【0269】

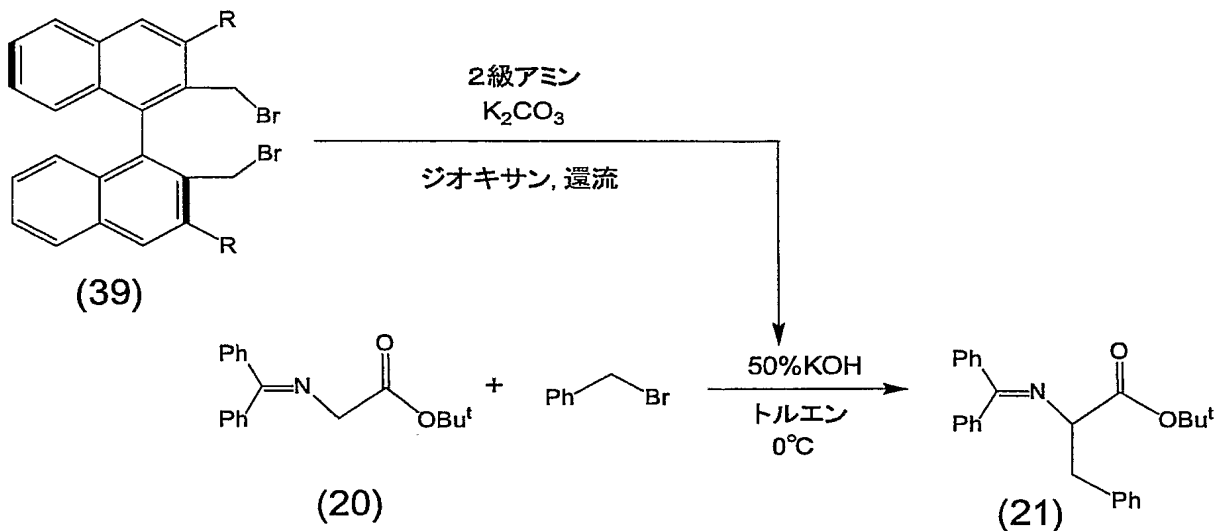
第1工程において、臭化アリルの代わりに $\alpha$ -ブromo酢酸tert-ブチルエステルを用い、相間移動触媒として化合物7を用いたこと以外は、上記実施例20と同様にして、化合物38を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した。収率は66%であり、光学純度は94% eeであった。

## 【0270】

<実施例24：1容器中での触媒形成およびベンジル化反応の検討>

## 【0271】

## 【化59】



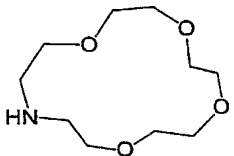
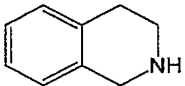
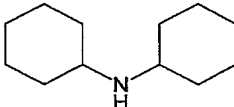

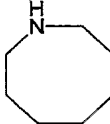
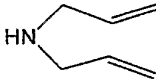
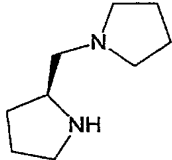
## 【0272】

ジオキサン (5 mL) 中、以下の表10に記載の化合物39 (S体) (3モル%)、以下の表10に記載の2級アミン (6 mol%)、および炭酸カリウム (4.5 mol%) を混合し、加熱還流下で10時間攪拌した。次いで、この反応混合物に、グリシンtert-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基 (化合物20) (1当量、0.5 mmol

)、50%水酸化カリウム水溶液(1.0 mL)、およびトルエン(3.0 mL)を加え、さらに臭化ベンジル(1.2当量)を0℃にて滴下した。0℃にてそれぞれ以下の表10に記載の時間攪拌した後、反応混合物を水に注ぎ、エーテルで抽出した。エーテル抽出物を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥して、減圧濃縮した。油状残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(エーテル/ヘキサン=1/10で溶出)に付し、(S)-フェニルアラニンtert-ブチルエステルベンゾフェノンシッフ塩基(化合物21)を得た。得られた生成物の光学純度は、HPLCにて分析した[Dai-Cell Chiralcel OD; 溶離液:ヘキサン/2-プロパノール=100:1、0.5 mL/分; 保持時間:(R)体=14.8分、(S)体=28.2分]。結果を表15にまとめて示す。

【0273】

【表 15】

2級アミン	R=H	R=Ph	R=3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Ph	R=3,4,5-F <sub>3</sub> Ph
(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> NH	12%ee (66%, 58時間)	26%ee (68%, 5日)	1%ee (57%, 30時間)	7%ee (44%, 4日)
(C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub> NH	-27%ee (53%, 72時間)	43%ee (89%, 54時間)	70%ee (85%, 48時間)	97%ee (76%, 24時間)
(C <sub>10</sub> H <sub>21</sub> ) <sub>2</sub> NH	-17%ee (76%, 90時間)	58%ee (86%, 24時間)	96%ee (96%, 24時間)	97%ee (86%, 72時間)
(iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub> NH	-9%ee (52%, 72時間)	22%ee (14%, 5日)	44%ee (34%, 24時間)	7%ee (65%, 4日)
	1%ee (59%, 72時間)	41%ee (86%, 36時間)	75%ee (50%, 4日)	83%ee (98%, 6時間)
	-19%ee (83%, 36時間)	-57%ee (71%, 4日)	78%ee (33%, 29時間)	81%ee (83%, 24時間)
	22%ee (44%, 51時間)	3%ee (72%, 4日)	2%ee (10%, 7日)	6%ee (13%, 6日)
	-7%ee (56%, 4日)	5%ee (78%, 24時間)	31%ee (24%, 4日)	43%ee (80%, 24時間)
	-23%ee (67%, 48時間)	33%ee (82%, 12時間)	41%ee (3%, 8日)	20%ee (72%, 48時間)
	-8%ee (54%, 24時間)	n.t.	n.t.	8%ee (23%, 7日)
	n.t.	n.t.	n.t.	10%ee (13%, 6日)

表の数値は、光学純度(%ee)を示す。表の括弧内の数値は、収率(%)および反応時間を示す。  
 光学純度において、-の数値は、反対の立体配置の生成物が得られたことを示す。  
 n.t.は、実験を行っていないことを示す。

## 【0274】

このように、相間移動触媒を単離することなく、 $\alpha$ -アミノ酸誘導体のアルキル化反応に使用し得ることがわかった。

## 【産業上の利用可能性】

## 【0275】

本発明によれば、より単純な構造のキラル相間移動触媒が提供される。この相間移動触

媒は、従来の化合物よりもより少ない工程により製造することができ、このことはコストの削減にもつながる。このような相間移動触媒は、 $\alpha$ -アルキル- $\alpha$ -アミノ酸誘導体および $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジアルキル- $\alpha$ -アミノ酸誘導体の合成に非常に有用である。このようにして合成されるアミノ酸誘導体は、増強された特性を有するペプチドの設計において、および有効な酵素インヒビターとして、ならびに種々の生物学的活性を有する化合物の合成用のキラル構築物ブロックとして、特別な役割を果たす。したがって、新規な食品や医薬品の開発に有用である。

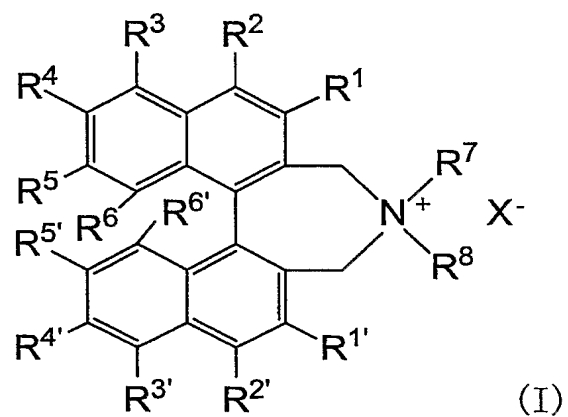
【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 より少ない工程で製造可能な、単純化された構造を有するキラル相間移動触媒を提供すること。

【解決手段】 以下の式 (I) の化合物：

【化 1】



この化合物 (I) は、比較的少ない工程で製造可能な 2, 2'-ジメチレンプロミド-1, 1'-ビナフチル誘導体と、入手が容易な 2 級アミンとを反応させることにより、製造できる。

【選択図】 なし

特願 2 0 0 4 - 0 2 3 3 1 7

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[ 0 0 0 2 1 4 2 7 2 ]

1. 変更新月日

1 9 9 0 年 8 月 3 0 日

[変更理由]

新規登録

住 所

大阪府大阪市西区新町 1 丁目 1 番 1 7 号

氏 名

長瀬産業株式会社